

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003年7月24日 (24.07.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/059880 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 207/335, 307/52,  
333/20, A61K 31/341, 31/40, 31/381, A61P 1/04, 1/16,  
3/10, 7/00, 7/06, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 17/00,  
17/06, 19/02, 21/00, 25/00, 25/14, 25/16, 25/18, 25/28,  
29/00, 31/04, 31/12, 35/02, 37/00, 37/06, 43/0058号 三共株式会社内 Tokyo (JP). 宮崎 正二郎  
(MIYAZAKI, Shojiro) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川  
区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/00136

(74) 代理人: 大野 彰夫, 外(OHNO, Akio et al.); 〒140-8710  
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社  
内 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2003年1月9日 (09.01.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

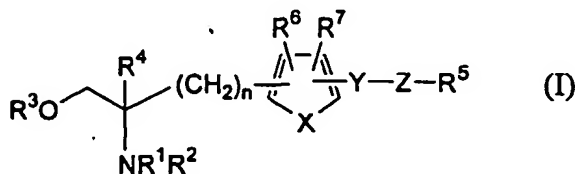
(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-004456 2002年1月11日 (11.01.2002) JP  
特願2002-004484 2002年1月11日 (11.01.2002) JP(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,  
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU,  
ZA, ZM, ZW.(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株  
式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒  
103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号  
Tokyo (JP).(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,  
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許  
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,  
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI  
特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 西 剛秀  
(NISHI, Takahide) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川  
区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo  
(JP). 下里 隆一 (SHIMOZATO, Takaichi) [JP/JP]; 〒  
140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号 三  
共株式会社内 Tokyo (JP). 奈良 太 (NARA, Futoshi)  
[JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番添付公開書類:  
— 国際調査報告書2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。(54) Title: AMINO ALCOHOL DERIVATIVE OR PHOSPHONIC ACID DERIVATIVE AND MEDICINAL COMPOSITION  
CONTAINING THESE

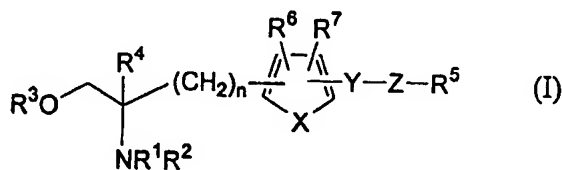
(54) 発明の名称: アミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体及びそれらを含有する医薬組成物

oxygen or nitrogen optionally substituted by lower alkyl, etc.; Y represents ethylene; Z represents C<sub>1-10</sub> alkylene; R<sup>5</sup> represents aryl  
or substituted aryl; and R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> each represents hydrogen; provided that when R<sup>5</sup> is hydrogen, then Z is neither a single bond  
nor linear C<sub>1-10</sub> alkylene.)(57) Abstract: An amino alcohol derivative or phosphonic  
acid derivative each having excellent immunosuppressive  
activity; a pharmacologically acceptable salt thereof or  
pharmacologically acceptable ester thereof; and a medicinal  
composition containing any of these. (I) (In the formula,  
R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> each represents hydrogen or an amino-protecting  
group; R<sup>3</sup> represents hydrogen or a hydroxy-protecting group;  
R<sup>4</sup> represents lower alkyl; n is an integer of 1 to 6; X represents

[続葉有]

(57) 要約:

本発明は、優れた免疫抑制作用を有するアミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル並びにそれらを含む医薬組成物に関する：



〔式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、水素原子、アミノ基の保護基； $R^3$ は、水素原子、ヒドロキシ基の保護基； $R^4$ は、低級アルキル基； $n$ は1乃至6の整数； $X$ は、酸素原子又は無置換若しくは低級アルキル基等により置換された窒素原子； $Y$ は、エチレン基； $Z$ は、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基； $R^5$ は、アリール基、置換されたアリール基； $R^6$ 及び $R^7$ は、水素原子；但し、 $R^5$ が水素原子であるとき、 $Z$ は単結合及び直鎖の $C_1-C_{10}$ アルキレン基以外の基を示す。〕



## 明 細 書

アミノアルコール誘導体又はホスホン酸誘導体及びそれらを含有する医薬組成物

## 〔技術分野〕

本発明は、優れた免疫抑制作用を有するアミノアルコール誘導体若しくはホスホン酸誘導体、アミノアルコール誘導体若しくはホスホン酸誘導体の薬理上許容される塩、アミノアルコール誘導体若しくはホスホン酸誘導体の薬理上許容されるエステル、又はそれらを有効成分として含有する医薬組成物に関する。

さらに、本発明は、免疫抑制剤と、優れた免疫抑制作用を有するアミノアルコール化合物若しくはホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩及びそのエステルからなる群より選ばれる化合物とを有効成分として含有し、臓器及び細胞移植における拒絶反応、リウマチやその他の自己免疫疾患等の免疫作用に関連する疾患の予防又は治療薬として優れる医薬組成物に関する。

## 〔背景技術〕

従来、リウマチやその他の自己免疫疾患等の免疫関連病の治療においては、異常な免疫反応によって生じる炎症反応に対してステロイドなどの抗炎症薬が使用されてきた。しかしながらこれら是对症療法であり根本的治療ではない。

また、糖尿病、腎炎の発症においても免疫系の異常が関与することは報告されているが、その異常を改善するような薬剤の開発には至っていない。

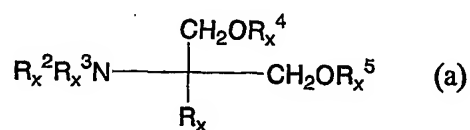
一方、免疫応答を抑制する方法の開発は、臓器及び細胞移植における拒絶反応を防いだり、種々の自己免疫疾患を治療及び予防する上でも極めて

重要である。しかしながら、シクロスポリンA（CsA）やタクロリムス（TRL）等の従来知られている免疫抑制剤は、腎臓及び肝臓に対して毒性を示すことが知られており、そのような副作用を軽減するために、ステロイド類を併用するなどの治療が広く用いられてきたが、必ずしも副作用を示すことなく十分な免疫抑制効果を発揮するには至っていないのが現状である。

このような背景から、毒性が低く、優れた免疫抑制作用を有する化合物を見出すことが試みられている。

免疫抑制剤としては、例えば、以下の化合物が知られている。

(1) 一般式 (a)

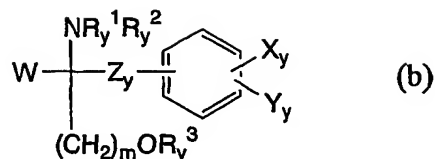


{上記化合物 (a) において、

$\text{R}_x$  は置換基を有してもよい直鎖または分岐鎖状の炭素鎖[当該鎖中に、二重結合、三重結合、酸素、硫黄、 $-\text{N}(\text{R}_x^6)-$  (式中、 $\text{R}_x^6$  は水素を示す。)、置換基を有してもよいアリーレン、置換基を有してもよいヘテロアリーレンを有してもよく、当該鎖端に、置換基を有してもよいアリール、置換基を有してもよいシクロアルキル、置換基を有してもよいヘテロアリールを有してよい。]であり、 $\text{R}_x^2$ 、 $\text{R}_x^3$ 、 $\text{R}_x^4$ 、 $\text{R}_x^5$  は、同一または異なって、水素、アルキルである。} を有する化合物が、免疫抑制剤として知られている。

かかる先行技術の上記化合物 (a) は、必須の置換基として、同一炭素原子に置換する2つのオキシメチル基 ( $-\text{CH}_2\text{OR}_x^4$  及び  $-\text{CH}_2\text{OR}_x^5$ ) を有するが、本発明の化合物は対応する基として、同一炭素原子に置換する  $-\text{CH}_2\text{OR}^3$  基と低級アルキル基を有している点で上記化合物 (a) と相違する。

## (2) 一般式 (b)



[上記化合物 (b) において、

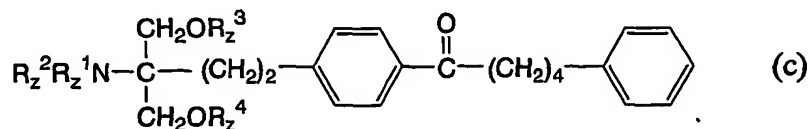
$\text{R}_y^1$ 、 $\text{R}_y^2$  及び  $\text{R}_y^3$  は、水素原子等であり、W は、水素原子、アルキル基等であり、 $\text{Z}_y$  は、単結合又はアルキレン基であり、 $\text{X}_y$  は、水素原子又はアルコキシ基であり、 $\text{Y}_y$  は、水素原子、アルキル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、アミノ、アシルアミノ基等を示す。]

を有する化合物が、免疫抑制剤として知られている。

上記化合物 (b) は、基本骨格中フェニル基を必須としているが、本発明の化合物 (I) は、対応する基がヘテロ環であるフラン基またはピロール基もしくは窒素原子に置換基を有するピロール基である点で、上記化合物 (b) と相違する。

更に本公報には、本発明の化合物 (I) の構造と類似するような構造を有する化合物は、具体的に全く開示されていない。

## (3) 一般式 (c)



[上記化合物 (c) において、

$\text{R}_z^1$ 、 $\text{R}_z^2$ 、 $\text{R}_z^3$ 、 $\text{R}_z^4$  は同一又は異なって、水素又はアシル基である。]

を有する化合物が、免疫抑制剤として知られている。

上記化合物 (c) は、必須の置換基として、同一炭素原子に置換する 2 つのオキシメチル基 ( $-\text{CH}_2\text{OR}_z^3$  及び  $-\text{CH}_2\text{OR}_z^4$ ) を有するが、本発明の化合物は対応する基として、同一炭素原子に置換する  $-\text{CH}_2\text{O}$

R<sup>3</sup>基と低級アルキル基を有している点で上記化合物(c)と相違する。また、上記化合物(c)は、基本骨格中-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-基と-CO-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-基の間にフェニル基を必須の基としているが、本発明の化合物(I)は、対応する基がヘテロ環であるフラン基またはピロール基もしくは窒素原子に置換基を有するピロール基である点でも、上記化合物(c)と相違する。

一方、上記一般式(II)を有する化合物で、Xが硫黄原子である本発明の化合物は、WO 02/06268号公報において、ヒドロキシ化合物の保護基がリン酸エステル塩残基である化合物として開示されている。

さらに、免疫抑制剤の併用について、免疫抑制剤であるFTY-720と、サイクロスポリンA又はタクロリムスとを併用する発明が、特開平11-80026号公報に開示されている。

このような背景から、毒性が低く、優れた免疫抑制作用を有する医薬組成物を見出すことが望まれている。

#### [発明の開示]

本発明者らは、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有する新規化合物に関して、長年に亘り鋭意検討を重ね他結果、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、パーチエット病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮

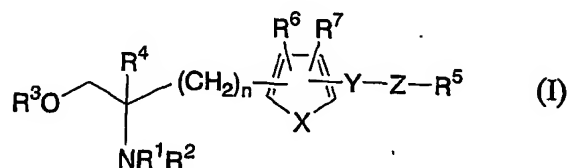
膚炎、日光過敏症、蕁瘡、Sydenham舞踏病、硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、さらに、真菌、マイコプラズマ、ウィルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈血栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞踏病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患（特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患）に有用である新規化合物を見出して、本発明を完成した。

さらに、本発明者らは、免疫抑制作用を有する医薬組成物について鋭意研究を行った結果、本発明の医薬組成物が、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有し、該組成物中に含有される免疫抑制剤のいずれの薬理効果をも増強して発揮し、かつ該免疫抑制剤単独では持ちうる副作用も低減させ、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、

アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、蕁瘡、Sydenham 舞蹈病、硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA 腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、さらに、真菌、マイコプラズマ、ウイルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞蹈病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患（特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患）に有用であることを見出し、本発明を完成した。

本発明を具体的に説明する。

(1) 本発明のアミノアルコール誘導体は、下記一般式 (I) を有する。



上記式中、

$\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

$\text{R}^3$  は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ基の保護基を示し、

$\text{R}^4$  は、低級アルキル基を示し、

n は、1 乃至 6 の整数を示し、

X は、酸素原子または式  $N-D$  を有する基（式中、D は水素原子、 $C_6-C_{10}$  アリール基、低級アルキルスルホニル基、 $C_6-C_{10}$  アリールスルホニル基又は置換基群 a から選択される基を示す。）を示し、

Y は、エチレン基、ピニレン基、エチニレン基、式  $-E-CH_2-$  を有する基（式中、E は、カルボニル基又は式  $-CH(OH)-$  を有する基を示す。）、 $C_6-C_{10}$  アリーレン基又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$  アリーレン基を示し、

Z は、単結合、 $C_1-C_{10}$  アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基を示し、

$R^6$  は、水素原子、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$  アリール基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 a から選択される基を示し、

置換基群 a は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

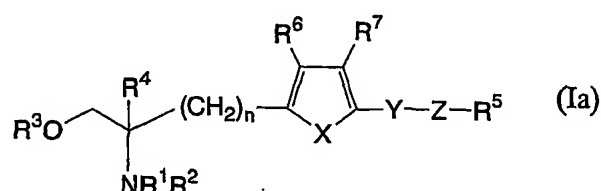
置換基群 b は、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$  が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示す。

本発明は、式 (I) を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを提供する。

これらのうち、好適には、

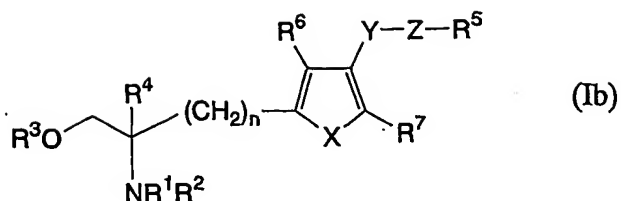
(2) (1) において、式 (I) を有する化合物が、式 (Ia) :



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、X、Y、Z 及び n は、前記におけるものと同意義を示す。) を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル、

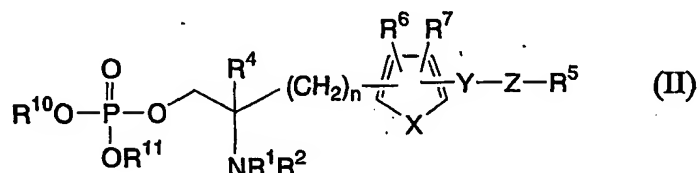
(3) (1) において、式 (I) を有する化合物が、式 (Ib) :





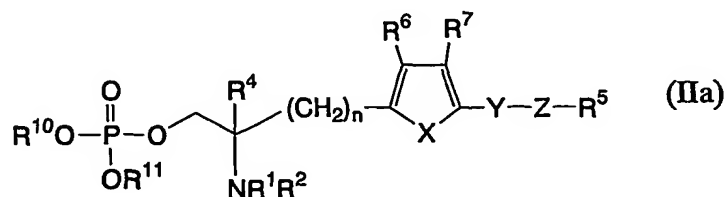
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル、

(4) (1)において、式(I)を有する化合物の薬理上許容されるエステルが、式(II)：



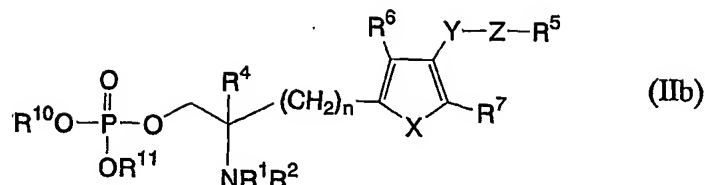
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示し、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩、

(5) (4)において、式(II)を有するエステルが、式(IIa)：



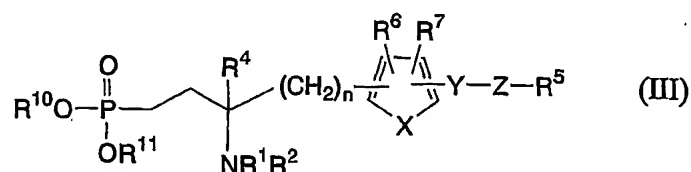
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示し、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩及び

(6) (4)において、式(II)を有するエステルが、式(IIb) :



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示し、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩である。

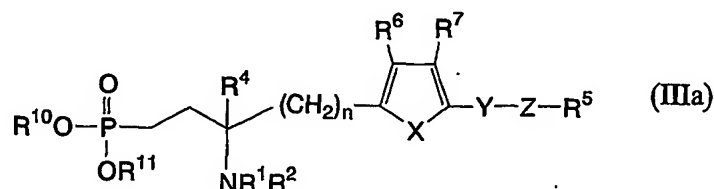
(7) 本発明のホスホン酸誘導体は、下記一般式(III)を有する :



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)

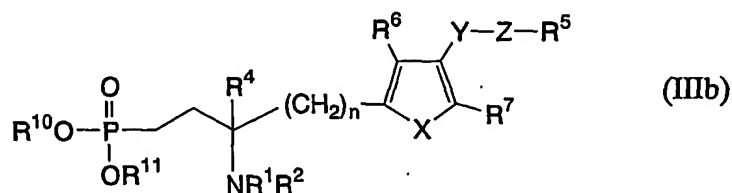
本発明は、式(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを提供する。これらのうち、好適には、

(8) (7)において、式(III)を有する化合物が、式(IIIa)



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル及び

(9) (7)において、式(III)を有する化合物が、式(IIIb)



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルである。

これらのうち、好適な化合物としては、

(10) (1)乃至(9)から選択される1項において、 $R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基、低級アルコキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(11) (1)乃至(9)から選択される1項において、 $R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(12) (1)乃至(9)から選択される1項において、 $R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1-C_4$ 脂肪族アシル基又は $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(13) (1)乃至(9)から選択される1項において、 $R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1-C_2$ 脂肪族アシル基又は $C_1-C_2$ アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(14) (1) 乃至 (9) から選択される 1 項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(15) (1) 乃至 (9) から選択される 1 項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(16) (1) 乃至 (3) 及び (10) 乃至 (15) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子、低級アルキル基、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された芳香族アシル基又はシリル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(17) (1) 乃至 (3) 及び (10) 乃至 (15) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(18) (1) 乃至 (3) 及び (10) 乃至 (15) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子又は  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(19) (1) 乃至 (3) 又は (10) 乃至 (15) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(20) (1) 乃至 (3) 及び (10) 乃至 (15) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(21) (1) 乃至 (20) から選択される 1 項において、 $R^4$  が、 $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(22) (1) 乃至 (20) から選択される 1 項において、 $R^4$  が、 $C_1 - C_2$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(23) (1) 乃至 (20) から選択される 1 項において、 $R^4$  が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(24) (1) 乃至 (23) から選択される 1 項において、n が、2 又

は3である化合物又はその薬理上許容される塩、

(25) (1)乃至(23)から選択される1項において、nが、2である化合物又はその薬理上許容される塩、

(26) (1)乃至(25)から選択される1項において、Xが、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(27) (1)乃至(25)から選択される1項において、Xが、式N-Dを有する基(式中、Dは水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基又はフェニル基を示す。)である化合物又はその薬理上許容される塩、

(28) (1)乃至(25)から選択される1項において、Xが、式 $-NCH_3$ を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(29) (1)乃至(28)から選択される1項において、Yが、エチレン基、エチニレン基、式 $-CO-CH_2-$ を有する基、式 $-CH(OH)-CH_2-$ を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(30) (1)乃至(28)から選択される1項において、Yが、エチレン基、エチニレン基、式 $-CO-CH_2-$ を有する基又はフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(31) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(32) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが $C_1-C_6$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(33) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが $C_1-C_5$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_5$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(34) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換されたエチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(35) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(36) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(37) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基(該置換基は、低級アルキル基及びヒドロキシ基からなる群から選択される基である。)である化合物又はその薬理上許容される塩、

(38) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(39) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(40) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有する $C_1-C_6$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(41) (1)乃至(30)から選択される1項において、Zが、 $-O-CH_2-$ 、 $-O-(CH_2)_2-$ 、 $-O-(CH_2)_3-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-(CH_2)_2-O-$ 又は $-(CH_2)_3-O-$ を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(42) (1) 乃至 (30) から選択される 1 項において、Z が、 $-CH_2-O-$  又は  $-(CH_2)_2-O-$  を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(43) (1) 乃至 (42) から選択される 1 項において、 $R^5$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(44) (1) 乃至 (42) から選択される 1 項において、 $R^5$  が、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基から成る群から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(45) (1) 乃至 (42) から選択される 1 項において、 $R^5$  が、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基及び低級アルコキシ基から成る群から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(46) (1) 乃至 (42) から選択される 1 項において、 $R^5$  が、 $C_5-C_6$  シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(47) (1) 乃至 (42) から選択される 1 項において、 $R^5$  が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(48) (1) 乃至 (47) から選択される 1 項において、 $R^6$  及び  $R^7$  が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(49) (1) 乃至 (47) から選択される 1 項において、 $R^6$  及び  $R^7$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩、

(50) (4) 乃至 (15) 及び (21) 乃至 (49) から選択される 1 項において、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  が、同一又は異なって、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(51) (4) 乃至 (15) 及び (21) 乃至 (49) から選択される 1 項において、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  が、同一又は異なって、水素原子又は  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩、

(52) (4) 乃至 (15) 及び (21) 乃至 (49) から選択される 1 項において、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  が、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩及び

(53) (4) 乃至 (15) 及び (21) 乃至 (49) から選択される 1 項において、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である。

上記 (1) の化合物において、(2) 乃至 (3); (10) 乃至 (15); (16) 乃至 (20); (21) 乃至 (23); (24) 乃至 (25); (26) 乃至 (28); (29) 乃至 (30); (31) 乃至 (42); (43) 乃至 (47); 並びに (48) 乃至 (49) からなる群から選択されるいずれか 1 項を任意に組み合わせた化合物も好適である。

上記 (4) の化合物において、(5) 乃至 (6); (10) 乃至 (15); (21) 乃至 (23); (24) 乃至 (25); (26) 乃至 (28); (29) 乃至 (30); (31) 乃至 (42); (43) 乃至 (47); (48) 乃至 (49); 並びに (50) 乃至 (53) からなる群から選択されるいずれか 1 項を任意に組み合わせた化合物も好適である。

上記 (7) の化合物において、(8) 乃至 (9); (10) 乃至 (15); (21) 乃至 (23); (24) 乃至 (25); (26) 乃至 (28); (29) 乃至 (30); (31) 乃至 (42); (43) 乃至 (47); (48) 乃至 (49); 並びに (50) 乃至 (53) からなる群から選択されるいずれか 1 項を任意に組み合わせた化合物も好適である。

これらのうち、特に好適な化合物としては、



(54) 下記から選択されるいずれか1つの化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル:

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール及び

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

(55) 下記から選択されるいずれか1つの化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル:

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール及び  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール。

(56) (4)において、下記から選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル及び  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}-1-ブチ

ル エステル、

(57) (4)において、下記から選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フ

エニルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル及び  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シ  
クロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、  
(58) (7) において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又  
はその薬理上許容される塩:

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル) フラン-  
2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-  
イニル) フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)  
フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-  
1-イニル) フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)  
フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキ  
シ) プロプ-1-イニル]フラン-2-イル} ペンチルホスホン酸、

(59) (7) において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又  
はその薬理上許容される塩:

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペント  
-1-イニル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフ  
ェノキシ) プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル} ペンチルホスホン  
酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシル  
オキシブト-1-イニル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(3, 4-ジメ  
チルフェノキシ) プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル} ペンチルホ

スホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸である。

さらに、本発明は、次に記載の医薬組成物も提供する。

(60) T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤、

DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキル化剤、

葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤、

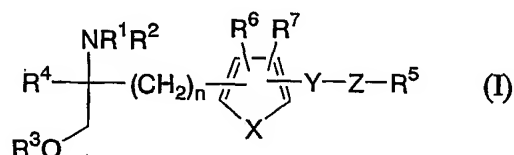
TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤、

細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反

応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤及び

プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤

からなる群より選択される少なくとも一つの免疫抑制剤と、下記一般式 (I) で示される化合物：



[式中、

$\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

$\text{R}^3$  は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ基の保護基を示し、

$\text{R}^4$  は、低級アルキル基を示し、

$n$  は、1 乃至 6 の整数を示し、

$\text{X}$  は、硫黄原子、酸素原子または式  $\text{N}-\text{D}$  を有する基（式中、 $\text{D}$  は水素原子、アリール基、低級アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基又は置換基群  $a$  から選択される基を示す。）を示し、

$\text{Y}$  は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式  $-\text{E}-\text{CH}_2-$  を有する基（式中、 $\text{E}$  は、カルボニル基、式  $-\text{CH}(\text{OH})-$  を有する基を示す。）、 $\text{C}_1-\text{C}_6$  アリーレン基又は置換基群  $a$  から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $\text{C}_1-\text{C}_6$  アリーレン基を示し、

$\text{Z}$  は、単結合、 $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、又は置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン

基を示し、

$R^5$ は、水素原子、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ アリール基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基を示し、

$R^6$ 及び $R^7$ は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群aから選択される基を示し、

置換基群aは、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノー低級アルキルアミノ基、ジー低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

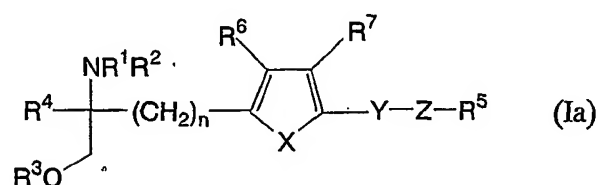
置換基群bは、 $C_1-C_6$ シクロアルキル基、 $C_1-C_6$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ シクロアルキル基、置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ アリール基、及び置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$ が水素原子であるとき、Yは分岐した $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示す。]

その薬理上許容される塩及びそのエステルからなる群より選ばれる少なくとも一つの化合物とからなる医薬組成物である。

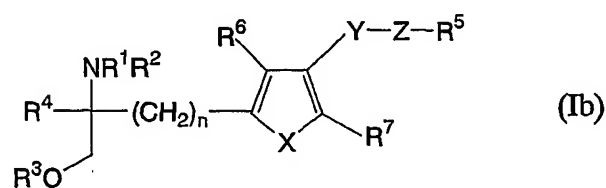
これらのうち、好適には、

(61) (60)において、一般式(I)で表される化合物が、下記一般式(Ia):



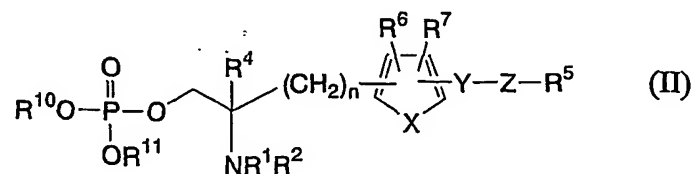
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X、Y、Z及びnは、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物である医薬組成物、

(62) (60)において、一般式(I)で表される化合物が、下記一般式(Ib):



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X、Y、Z及びnは、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物である医薬組成物、

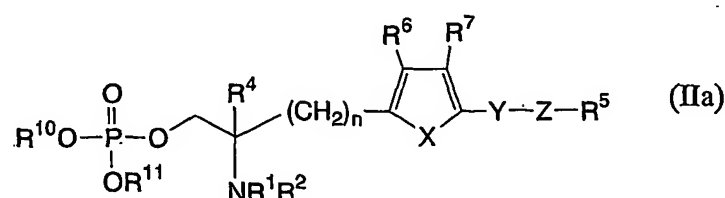
(63) (60)において、式(I)を有する化合物の薬理上許容されるエステルが、式(II):





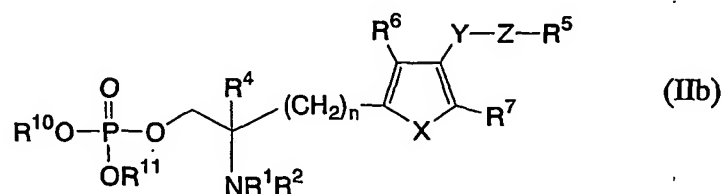
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示し、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(64) (63)において、式(II)を有するエステルが、式(IIa):



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物及び

(65) (63)において、式(II)を有するエステルが、式(IIb):

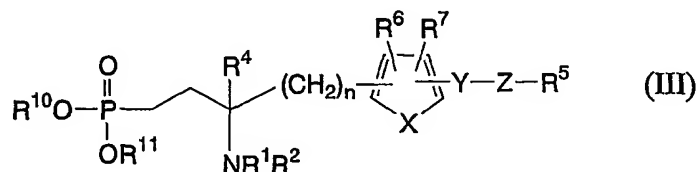


(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前記におけるものと同意義を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物である。

さらに、本発明は、次に示す医薬組成物を提供する。

(66) T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤、  
 免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する  
 薬剤、  
 DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキ  
 ル化剤、  
 葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤、  
 TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤、  
 細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反  
 応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示  
 すステロイドホルモン剤及び  
 プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジ  
 ンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤  
 からなる群より選択される少なくとも一つの免疫抑制剤と、下記一般式（  
 III）で示される化合物：



〔式中、

$\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミ  
 ノ基の保護基を示し、

$\text{R}^4$  は、低級アルキル基を示し、

$n$  は、1 乃至 6 の整数を示し、

$\text{X}$  は、硫黄原子、酸素原子または式  $\text{N}-\text{D}$  を有する基（式中、 $\text{D}$  は水素  
 原子、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリール基、低級アルキルスルホニル基、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  ア  
 リールスルホニル基又は置換基群  $a$  から選択される基を示す。）を示し、

$\text{Y}$  は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式  $-\text{E}-\text{CH}_2-$  を有す  
 る基（式中、 $\text{E}$  は、カルボニル基又は式  $-\text{CH}(\text{OH})-$  を有する基を示

す。)、 $C_6-C_{10}$ アリーレン基又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリーレン基を示し、

Z は、単結合、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示し、

$R^5$  は、水素原子、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリール基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 a から選択される基を示し、

$R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示し、

置換基群 a は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

置換基群 b は、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C

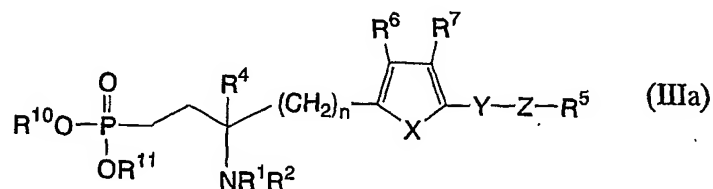
$6-C_{10}$ アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$ が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示す。]

を有する化合物又はその薬理上許容される塩及びそのエステルからなる群より選ばれる少なくとも一つの化合物とからなる医薬組成物である。

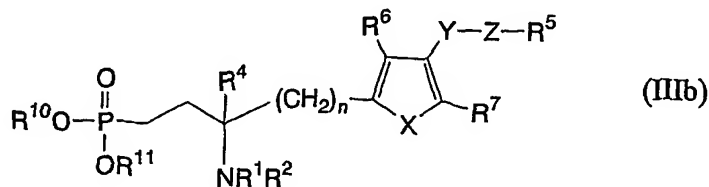
これらのうち、好適には、

(67) (66) において、式 (III) を有する化合物が、式 (III a) :



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、X、Y、Z 及び n は、前記におけるものと同意義を示す。) を有する化合物である医薬組成物及び

(68) (66) において、式 (III) を有する化合物が、式 (III b) :



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、X、Y、Z 及び

n は、前記におけるものと同意義を示す。) を有する化合物である医薬組成物である。

上記医薬組成物のうち、さらに好適には、

(69) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基、低級アルコキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(70) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(71) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 - C_4$  脂肪族アシル基又は  $C_1 - C_4$  アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(72) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$  脂肪族アシル基又は  $C_1 - C_2$  アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(73) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(74) (60) 乃至 (68) から選択される1項において、 $R^1$  及び  $R^2$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(75) (60) 乃至 (62) 及び (69) 乃至 (74) から選択される1項において、 $R^3$  が、水素原子、低級アルキル基、低級脂肪族アシル

基、芳香族アシル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された芳香族アシル基又はシリル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(76) (60) 乃至 (62) 及び (69) 乃至 (74) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(77) (60) 乃至 (62) 及び (69) 乃至 (74) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子又は  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(78) (60) 乃至 (62) 及び (69) 乃至 (74) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(79) (60) 乃至 (62) 及び (69) 乃至 (74) から選択される 1 項において、 $R^3$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(80) (60) 乃至 (79) から選択されるいずれか 1 項において、 $R^4$  が、 $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(81) (60) 乃至 (79) から選択されるいずれか 1 項において、 $R^4$  が、 $C_1 - C_7$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(82) (60) 乃至 (79) から選択されるいずれか 1 項において、 $R^4$  が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(83) (60) 乃至 (82) から選択されるいずれか 1 項において、 $n$  が、2 又は 3 である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(84) (60) 乃至 (82) から選択されるいずれか 1 項において、

nが、2である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(85) (60) 乃至 (84) から選択されるいずれか1項において、Xが、硫黄原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(86) (60) 乃至 (84) から選択されるいずれか1項において、Xが、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(87) (60) 乃至 (84) から選択されるいずれか1項において、Xが、式N-Dを有する基(式中、Dは水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基又はフェニル基を示す。)である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(88) (60) 乃至 (84) から選択されるいずれか1項において、Xが、式N-CH<sub>3</sub>を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(89) (60) 乃至 (88) から選択されるいずれか1項において、Yが、エチレン基、エチニレン基、式-CO-CH<sub>2</sub>-を有する基、式-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(90) (60) 乃至 (88) から選択されるいずれか1項において、Yが、エチレン基、エチニレン基、式-CO-CH<sub>2</sub>-を有する基又はフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(91) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、Zが、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(92) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、

Zが $C_1-C_6$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(93) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが $C_1-C_5$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_5$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(94) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換されたエチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(95) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(96) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(97) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基

(該置換基は、低級アルキル基及びヒドロキシ基からなる群から選択される基である。)である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(98) (60)乃至(90)から選択されるいずれか1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、



(99) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(100) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有する  $C_1-C_6$  アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(101) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、Zが、 $-O-CH_2-$ 、 $-O-(CH_2)_2-$ 、 $-O-(CH_2)_3-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-(CH_2)_2-O-$  又は  $-(CH_2)_3-O-$  を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(102) (60) 乃至 (90) から選択されるいずれか1項において、Zが、 $-CH_2-O-$  又は  $-(CH_2)_2-O-$  を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(103) (60) 乃至 (102) から選択されるいずれか1項において、 $R^5$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(104) (60) 乃至 (102) から選択されるいずれか1項において、 $R^5$ が、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基から成る群から選択される基で1乃至3個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(105) (60) 乃至 (102) から選択されるいずれか1項において、 $R^5$ が、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基及び低級アルコキシ基から成る群から選択される基で1乃至3個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(106) (60) 乃至 (102) から選択されるいずれか1項において、 $R^5$ が、 $C_5-C_6$ シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(107) (60) 乃至 (102) から選択されるいずれか1項において、 $R^5$ が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(108) (60) 乃至 (107) から選択されるいずれか1項において、 $R^6$ 及び $R^7$ が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(109) (60) 乃至 (107) から選択されるいずれか1項において、 $R^6$ 及び $R^7$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(110) (63) 乃至 (74) 及び (80) 乃至 (109) から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(111) (63) 乃至 (74) 及び (80) 乃至 (109) から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子又は $C_1-C_4$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物、

(112) (63) 乃至 (74) 及び (80) 乃至 (109) から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物及び

(113) (63) 乃至 (74) 及び (80) 乃至 (109) から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物である。

これらのうち、特に好適には、

(114) (60)において、一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント

－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[5－(4－メトキシフェニル)ペン  
ト－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－メチルフェノキシ)プロ  
プ－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－エチルフェノキシ)プロ  
プ－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－メチルチオフェノキシ)  
プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－シクロヘキシルオキシブト  
－1－イニル)チオフェン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－フルオロフェノキシ)ブ  
ト－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－メチルフェノキシ)ブト  
－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(3－シクロヘキシルメトキシ)プロ  
プ－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－ベンジルオキシブト－1－イ  
ニル)チオフェン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－シクロヘキシルブタノイル)チ  
オフェン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－フェニルブタノイル)チオフェ  
ン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペンタノイル)  
チオフェン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－[5－(5－フェニルペンタノイル)チオフ  
ェン－2－イル]ブタン－1－オール、  
2－アミノ－2－メチル－4－{5－[5－(4－フルオロフェニル)ペンタ

ノイル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール及び  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、

(115) (60)において、一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-

2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール及び

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

(116) (60)において、一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペ

ンタノイル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイ  
 ル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブ  
 タノイル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノ  
 イル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペ  
 ンタノイル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイ  
 ル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール及び  
 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシル  
 ブタノイル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

(117) (63)において、一般式(II)を有する化合物、その薬  
 理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記  
 化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルから  
 なる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシ  
 ルブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシ  
 ルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペン  
 チル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシ  
 ルオキシブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロ  
 フェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、  
 リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシ

フェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ペンジルオキシ  
シブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシ  
ルプト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルプト  
-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシ  
ルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペン  
ト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロ  
フェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エ  
ステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシ  
フェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エ  
ステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフ  
ェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エ  
ステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフ  
ェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エ  
ステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチ  
オフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル  
エステル、  
リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシ  
ルオキシプト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エス



テル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

(118) (63)において、一般式(II)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}-1-ブチル エステル、

(119) (63)において、一般式(I I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イ

ル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

(120) (66)において、一般式(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルメトキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

(121) (66)において、一般式(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

(1 2 2) (6 6)において、一般式(I I I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノール-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸及び



3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシル  
プタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

(123) (60)乃至(122)から選択されるいずれか1項にお  
いて、免疫抑制剤が、

T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害す  
る作用を有する薬剤(該薬剤は、サイクロスポリンA、タクロリムス、ラ  
パマイシン、グスペリムス、エベロリムス、トレスペリムス、アニスペリ  
ムス、SDZ-281-240、ABT-281、チグデリムス、A-1  
19435又は17-エチル-1,14-ジヒドロキシー12-[2-[4-  
(2-フェニルヒドラジノカルボニルオキシ)-3-メトキシシクロヘ  
キシル]-1-メチルビニル]-23,25-ジメトキシ-13,19,2  
1,27-テトラメチル-11,28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[  
22.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2,3,10,16-  
テトロンである。)、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成阻害する作用を有する薬剤(該薬剤は  
、ミゾリピン、アザチオプリン、ミコフェノール酸、レフルノマイド、メ  
リメンポディブ、HMR-1279、TSK-204又はSP-1000  
30である。)、

免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有す  
る薬剤(該薬剤は、T-614、アクタリット、サラゾスルファピリジン  
又はCDC-801である。)、

DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアル  
キル化剤(該アルキル化剤は、シクロフォスファミドである。)、

葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤(該代謝拮抗剤は、  
メトトレキサートである。)、

TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤(該蛋白質製剤は、レミケード  
、エンブレル、ダクリズマブ、バシリキシマブ、アルムツズマブ、オマリ  
ズマブ、BMS-188667、CDP-571、イノリモマブ、ATM

－ 0 2 7 又は B T I － 3 2 2 である。）、

細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤（該ステロイドホルモン剤は、プレドニゾロンである。）又は

プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤（該非ステロイド系抗炎症剤は、ロキソプロフェンナトリウム、ジクロフェナックナトリウム、メロキシカム、セレコキシブ、ロフェコキシブである。）

からなる群より選択される少なくとも一つの薬剤である医薬組成物及び  
( 1 2 4 ) ( 6 0 ) 乃至 ( 1 2 2 ) から選択されるいずれか 1 項において、免疫抑制剤が、

サイクロスポリン A、タクロリムス、ラパマイシン、レフルノマイド、メトトレキセート、レミケード及びエンブレルからなる群より選択される少なくとも一つの薬剤である医薬組成物である。

また、本発明の他の目的は、

( 1 2 5 ) ( 1 ) 乃至 ( 5 9 ) から選択されるいずれか 1 項に記載される化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する医薬組成物、

( 1 2 6 ) 自己免疫疾患の予防又は治療のための、( 1 2 5 ) に記載の医薬組成物、

( 1 2 7 ) 自己免疫疾患が慢性関節リウマチである、( 1 2 6 ) に記載の医薬組成物及び

( 1 2 8 ) 臓器移植での拒絶反応を抑制するための、( 1 2 5 ) に記載の医薬組成物並びに

( 1 2 9 ) ( 6 0 ) 乃至 ( 1 2 5 ) から選択されるいずれか 1 項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする自己

免疫疾患の予防又は治療方法、

(130) (60) 乃至 (125) から選択されるいずれか1項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする慢性関節リウマチの予防又は治療方法及び

(131) クレーム60乃至125から選択されるいずれか1項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする臓器移植での拒絶反応の予防又は治療方法を提供することである。

上記式 (I)、(II) 及び (III) において、D、R<sup>5</sup> 及び置換基群 b の定義における「C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリール基」、「置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換された C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリール基」及び「置換基群 a 及び b から選択される基で1乃至3個置換された C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリール基」のアリール部分は、例えば、フェニル、インデニル、ナフチルであり得、好適にはフェニル又はナフチル基であり、最も好適にはフェニル基である。

Y 及び E の定義における「C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリーレン基」、「置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換された C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリーレン基」及び「置換基群 a 及び b から選択される基で1乃至3個置換された C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリーレン基」のアリーレン部分は、例えば、フェニレン、インデニレン、ナフチレンであり得、好適には、フェニレン又はナフチレン基であり、最も好適には、フェニレン基である。

Z の定義における「C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基」及び「置換基群 a 及び b から選択される基で1乃至3個置換された C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン基」の C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキレン部分は、メチレン、メチルメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、1-メチルエチレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、3-メチルトリメチレン、1-メチルプロピレン、1, 1-ジメチルエチレン、ペンタメチレン、1-

メチルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、3-メチルテトラメチレン、4-メチルテトラメチレン、1, 1-ジメチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、3, 3-ジメチルトリメチレン、ヘキサメチレン、1-メチルペンタメチレン、2-メチルペンタメチレン、3-メチルペンタメチレン、4-メチルペンタメチレン、5-メチルペンタメチレン、1, 1-ジメチルテトラメチレン、2, 2-ジメチルテトラメチレン、3, 3-ジメチルテトラメチレン、4, 4-ジメチルテトラメチレン、ヘプタメチレン、1-メチルヘキサメチレン、2-メチルヘキサメチレン、5-メチルヘキサメチレン、3-エチルペンタメチレン、オクタメチレン、2-メチルヘプタメチレン、5-メチルヘプタメチレン、2-エチルヘキサメチレン、2-エチル-3-メチルペンタメチレン、3-エチル-2-メチルペンタメチレン、ノナメチレン、2-メチルオクタメチレン、7-メチルオクタメチレン、4-エチルヘプタメチレン、3-エチル-2-メチルヘキサメチレン、2-エチル-1-メチルヘキサメチレン、デカメチレン基のような炭素数1乃至10個の直鎖又は分枝鎖アルキレン基であり得、好適には、 $C_1-C_6$ アルキレン基であり、更に好適には、 $C_1-C_5$ アルキレン基であり、より好適には、エチレン、トリメチレン又はテトラメチレン基であり、最も好適には、エチレン又はトリメチレン基である。

Zの定義における「炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基」及び「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基」の、「炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン」部分は、上記「 $C_1-C_{10}$ アルキレン基」の鎖端若しくは鎖中に酸素原子若しくは硫黄原子を有する基であり、例えば、 $-O-CH_2-$ 、 $-O-(CH_2)_2-$ 、 $-O-(CH_2)_3-$ 、 $-O-(CH_2)_4-$ 、 $-O-(CH_2)_5-$ 、 $-O-(CH_2)_6-$ 、 $-O-(CH_2)_7-$ 、 $-O-(CH_2)_8-$ 、 $-O-(CH_2)_9-$

$-\text{O}-(\text{CH}_2)_{10}-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_5-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_5-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_6-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_7-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_8-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_9-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_{10}-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_4-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_5-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_6-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_7-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_8-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_9-$ ,  $-\text{S}-(\text{CH}_2)_{10}-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_4-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_4-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{S}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-(\text{CH}_2)_5-\text{S}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_3-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_4-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_5-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_6-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_7-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_8-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_9-\text{S}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_{10}-\text{S}-$ を有する基であり得、好適には、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有する $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキレン基であり、更に好適には、 $-\text{O}-\text{CH}_2-$ ,  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-$ ,  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_3-$ ,  $-\text{CH}_2-\text{O}-$ ,  $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$ 又は $-(\text{CH}_2)_3-\text{O}-$ を有する基であり、最も好適には、 $-\text{CH}_2-\text{O}-$ 又は $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-$ を有する基である。

$\text{R}^5$  及び置換基群 b の定義における「 $\text{C}_3-\text{C}_{10}$ シクロアルキル基」、「置

換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基」及び「置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基」の  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル部分は、ベンゼン環のような他の環式基と縮環していてもよく、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、ノルボルニル、アダマンチル又はインダニルであり得、好適には、 $C_5-C_6$  シクロアルキル基であり、最も好適には、シクロヘキシル基である。

$R^5$  及び置換基群 b の定義における「硫黄原子、酸素原子又は／及び窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基」、「置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子又は／及び窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基」及び「置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子又は／及び窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基」の硫黄原子、酸素原子又は／及び窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基部分は、例えば、硫黄原子、酸素原子又は／及び窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員芳香族、又は部分若しくは完全還元型の飽和複素環基を示し、例えば、フリル、チエニル、ピロリル、アゼピニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピラニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、テトラヒドロピラニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、オキサゾリジニル、イソキサゾリジニル、チアゾリジニル又はピラゾリジニルであり得、好適には、5 乃至 6 員芳香族複素環基であり、最も好適には、フリル、チエニル又はピロリルであり、より更に好適には、フリル又はチエニルであり、更に好適にはチエニルである。

尚、上記「芳香族複素環基」は、他の環式基と縮環していてもよく、例

えば、ベンゾチエニル、イソベンゾフラニル、クロメニル、キサントニル、フェノキサチイニル、インドリジニル、イソインドリル、インドリル、インダゾリル、プリニル、キノリジニル、イソキノリル、キノリル、フタラジニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、キナゾリニル、カルバゾリル、カルボリニル、アクリジニル又はイソインドリニルであり得、好適には、ベンゾチエニル基である。

置換基群 a の定義における「ハロゲン原子」は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子であり、好適には、フッ素原子又は塩素原子である。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び置換基群 a の定義における「低級アルキル基」は、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、イソペンチル、2-メチルブチル、ネオペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、4-メチルペンチル、3-メチルペンチル、2-メチルペンチル、1-メチルペンチル、3, 3-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、1, 2-ジメチルブチル、1, 3-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルキル基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$  アルキル基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$  アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

置換基群 a の定義における「ハロゲン低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」にハロゲン原子が置換した基を示し、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、フルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-ブロモエチル、2-クロロエチル、2-フルオロエチル、2-ヨードエチル、3-クロロプロピル、4-フルオロブチ

ル、6-ヨードヘキシル、2, 2-ジブロモエチル基のようなハロゲノ  $C_1-C_6$  アルキル基であり得、好適には、ハロゲノ  $C_1-C_4$  アルキル基であり、更に好適には、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル又は2, 2, 2-トリクロロエチルであり、最も好適にはトリフルオロメチル基である。

置換基群 a の定義における「低級アルコキシ基」は、前記「低級アルキル基」が酸素原子に結合した基を示し、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ、2-メチルブトキシ、1-エチルプロポキシ、2-エチルプロポキシ、ネオペントキシ、ヘキシルオキシ、4-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3, 3-ジメチルブトキシ、2, 2-ジメチルブトキシ、1, 1-ジメチルブトキシ、1, 2-ジメチルブトキシ、1, 3-ジメチルブトキシ、2, 3-ジメチルブトキシ基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基であり得、好適には、 $C_1-C_4$  アルコキシ基であり、更に好適には、 $C_1-C_2$  アルコキシ基であり、最も好適には、メトキシ基である。

置換基群 a の定義における「低級アルキルチオ基」は、前記「低級アルキル基」が硫黄原子に結合した基を示し、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、ペンチルチオ、イソペンチルチオ、2-メチルブチルチオ、ネオペンチルチオ、ヘキシルチオ、4-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3, 3-ジメチルブチルチオ、2, 2-ジメチルブチルチオ、1, 1-ジメチルブチルチオ、1, 2-ジメチルブチルチオ、1, 3-ジメチルブチルチオ、2, 3-ジメチルブチルチオ基のような炭素数1乃至6個の直鎖又は分枝鎖



アルキルチオ基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$ アルキルチオ基であり、最も好適には、メチルチオ基である。

置換基群 a の定義における「低級アルコキシカルボニル基」は、前記「低級アルコキシ基」がカルボニル基に結合した基を示し、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、ペントキシカルボニル、イソペントキシカルボニル、2-メチルブトキシカルボニル、ネオペントキシカルボニル、ヘキシロキシカルボニル、4-メチルペントキシカルボニル、3-メチルペントキシカルボニル、2-メチルペントキシカルボニル、3, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 1-ジメチルブトキシカルボニル、1, 2-ジメチルブトキシカルボニル、1, 3-ジメチルブトキシカルボニル、2, 3-ジメチルブトキシカルボニル基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルコキシカルボニル基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$ アルコキシカルボニル基であり、最も好適には、メトキシカルボニル基である。

置換基群 a の定義における「低級脂肪族アシル基」は、水素原子又は飽和若しくは不飽和の鎖状炭化水素基がカルボニル基に結合した基を示し、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、アクリロイル、メタクリロイル、クロトノイル基のような炭素数 1 乃至 8 個の直鎖又は分枝鎖低級脂肪族アシル基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$ 低級脂肪族アシル基であり、更に好適には、アセチル又はプロピオニル基であり、最も好適には、アセチル基である。

置換基群 a の定義における「モノー低級アルキルアミノ基」は、前記「低級アルキル基」が 1 個アミノ基に結合したものと同意義を示し、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、s-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、2-メチルブチルアミノ、ネオペンチルアミノ、1-エチルプロピルアミノ、ヘキシルアミノ、イソヘキシルアミノ、4-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、3, 3-ジメチルブチルアミノ、2, 2-ジメチルブチルアミノ、1, 1-ジメチルブチルアミノ、1, 2-ジメチルブチルアミノ、1, 3-ジメチルブチルアミノ、2, 3-ジメチルブチルアミノ、2-エチルブチルアミノ基のようなモノーC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基であり得、好適には、モノーC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルアミノ基であり、更に好適にはモノーC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルアミノ基であり、最も好適にはメチルアミノ基である。

置換基群 a の定義における「ジー低級アルキルアミノ基」は、前記「低級アルキル基」が 2 個アミノ基に結合した基を示し、例えば、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ基のようなジ- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基であり得、好適には、ジ- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルアミノ基であり、更に好適には、ジ- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキルアミノ基であり、最も好適には、ジメチルアミノ基である。

置換基群 a の定義における「低級脂肪族アシルアミノ基」は、前記「低級脂肪族アシル基」がアミノ基に結合した基を示し、例えば、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチ

リルアミノ、バレリルアミノ、イソバレリルアミノ、ピバロイルアミノ、ヘキサノイルアミノ、アクリロイルアミノ、メタクリロイルアミノ、クロトノイルアミノ基のような炭素数 1 乃至 7 個の直鎖又は分枝鎖低級脂肪族アシルアミノ基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$  脂肪族アシルアミノ基であり、更に好適には、アセチルアミノ又はプロピオニルアミノ基であり、最も好適には、アセチルアミノ基である。

D の定義における「低級アルキルスルホニル基」とは、前記「低級アルキル基」がスルホニル基に結合した基を示し、例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル、プロパンスルホニル、イソプロパンスルホニル、ブタンスルホニル、イソブタンスルホニル、s-ブタンスルホニル、t-ブタンスルホニル、ペンタンスルホニル、イソペンタンスルホニル、2-メチルブタンスルホニル、ネオペンタンスルホニル、ヘキサンスルホニル、4-メチルペンタンスルホニル、3-メチルペンタンスルホニル、2-メチルペンタンスルホニル、3, 3-ジメチルブタンスルホニル、2, 2-ジメチルブタンスルホニル、1, 1-ジメチルブタンスルホニル、1, 2-ジメチルブタンスルホニル、1, 3-ジメチルブタンスルホニル、2, 3-ジメチルブタンスルホニル基のような炭素数 1 乃至 6 個の直鎖又は分枝鎖アルキルスルホニル基であり得、好適には、 $C_1 - C_4$  アルキルスルホニル基であり、更に好適には、 $C_1 - C_2$  アルキルスルホニル基であり、最も好適には、メタンスルホニル基である。

D の定義における「アリールスルホニル基」とは、前記「アリール基」がスルホニル基に結合した基を示し、例えば、ベンゼンスルホニル、p-トルエンスルホニル、o-キシレン-4-スルホニル、m-キシレン-4-スルホニル、p-キシレンスルホニル、ナフタレンスルホニル基のような炭素数 6 乃至 10 個のアリールスルホニル基であり得、最も好適には、

ベンゼンスルホニル基である。

$R^1$  及び  $R^2$  の定義における「アミノ基の保護基」とは、有機合成化学の分野で一般的に使用されるアミノ基の保護基を意味し、例えば、

前記「低級脂肪族アシル基」、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチルのようなハロゲン低級脂肪族アシル基、メトキシアセチルのような低級アルコキシで置換された低級脂肪族アシル基などの「脂肪族アシル類」；

ベンゾイル、1-インダンカルボニル、2-インダンカルボニル、1-若しくは2-ナフトイルのような芳香族アシル基、4-クロロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2, 4, 6-トリメチルベンゾイル、4-トルオイル、4-アニソイル、4-ニトロベンゾイル、2-ニトロベンゾイル、2-(メトキシカルボニル)ベンゾイル、4-フェニルベンゾイルのような前記置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基などの「芳香族アシル類」；

前記「低級アルコキシカルボニル基」、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル、2-トリメチルシリルエトキシカルボニルのようなハロゲンまたはトリ低級アルキルシリルで置換された低級アルコキシカルボニル基などの「アルコキシカルボニル類」；

ビニルオキシカルボニル、アリルオキシカルボニルのような「アルケニルオキシカルボニル類」；

ベンジルオキシカルボニルのようなアラルキルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル、3, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル、2-ニトロベンジルオキシカルボニル、4-ニトロベンジルオキシカルボニルのような前記置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基などの「アラルキルオキシカルボニル類」；

トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジメチルシリル、

t-ブチルジメチルシリル、メチルジイソプロピルシリル、メチルジ-t-ブチルシリル、トリイソプロピルシリルのようなトリ低級アルキルシリル基、ジフェニルメチルシリル、ジフェニルブチルシリル、ジフェニルイソプロピルシリル、フェニルジイソプロピルシリルのようなアリールまたはアリールと低級アルキルとでトリ置換されたシリル基などの「シリル類」；

ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、 $\alpha$ -ナフチルメチル、 $\beta$ -ナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、9-アンスリルメチルのような1乃至3個のアリール基で置換された低級アルキル基、4-メチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、3, 4, 5-トリメチルベンジル、4-メトキシベンジル、4-メトキシフェニルジフェニルメチル、2-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-ブロモベンジル、4-シアノベンジル、4-シアノベンジルジフェニルメチル、ビス(2-ニトロフェニル)メチル、ピペロニルのような低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ハロまたはシアノでアリール環が置換された1~3個のアリール基で置換された低級アルキル基などの「アラルキル類」；ならびに

N, N-ジメチルアミノメチレン、ベンジリデン、4-メトキシベンジリデン、4-ニトロベンジリデン、サリシリデン、5-クロロサリシリデン、ジフェニルメチレン、(5-クロロ-2-ヒドロキシフェニル)フェニルメチレンのような「シッフ塩基を形成する置換されたメチレン基」が包含され、好適には、低級脂肪族アシル基、低級アルコキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基である。

上記「アミノ基の保護基」として、特に好適には、アセチル基又はt-ブトキシカルボニル基である。

R<sup>3</sup>の定義における「ヒドロキシ基の保護基」とは、加水素分解、加水

分解、電気分解、光分解のような化学的方法により開裂し得る「反応における一般的保護基」、及び、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」を示す。

そのような「反応における一般的保護基」としては、例えば、

前記「脂肪族アシル類」；

前記「芳香族アシル類」；

テトラヒドロピラン-2-イル、3-ブromotetraヒドロピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロピラン-4-イル、テトラヒドロチオピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロチオピラン-4-イルのような「テトラヒドロピラニル又はテトラヒドロチオピラニル類」；

テトラヒドロフラン-2-イル、テトラヒドロチオフラン-2-イルのような「テトラヒドロフラニル又はテトラヒドロチオフラニル類」；

前記「シリル類」；

メトキシメチル、1,1-ジメチル-1-メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、ブトキシメチル、t-ブトキシメチルのような低級アルコキシメチル基、2-メトキシエトキシメチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシメチル基、2,2,2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲン低級アルコキシメチル等の「アルコキシメチル基」；

1-エトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチルのような低級アルコキシ化エチル基、2,2,2-トリクロロエチルのようなハロゲン化エチル基等の「置換エチル類」；

前記「アラルキル類」；

前記「アルコキシカルボニル類」；

前記「アルケニルオキシカルボニル類」；

前記「アラルキルオキシカルボニル基」を挙げることができる。

一方、「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」としては、例えば、エチルカルボニルオキシメチル、ピバロイルオキ

シメチル、ジメチルアミノアセトキシメチル、1-アセトキシエチルのようなアシルオキシアルキル類；

1-（メトキシカルボニルオキシ）エチル、1-（エトキシカルボニルオキシ）エチル、エトキシカルボニルオキシメチル、1-（イソプロポキシカルボニルオキシ）エチル、1-（tert-ブトキシカルボニルオキシ）エチル、1-（エトキシカルボニルオキシ）プロピル、1-（シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ）エチルのような1-（アルコキシカルボニルオキシ）アルキル類；

フタリジル基；

4-メチルーオキシジオキシソレニルメチル、4-フェニルーオキシジオキシソレニルメチル、オキシジオキシソレニルメチルのようなオキシジオキシソレニルメチル基等の「カルボニルオキシアルキル類」；

前記「脂肪族アシル類」；

前記「芳香族アシル類」；

「コハク酸のハーフエステル塩残基」；

「リン酸エステル塩残基」；

「アミノ酸等のエステル形成残基」；

カルバモイル基；

ペンジリデンのようなアラルキリデン基；メトキシエチリデン、エトキシエチリデンのようなアルコキシエチリデン基；オキシメチレン；チオキシメチレンのような「2つのヒドロキシ基の保護基」；

及び、ピバロイルオキシメチルオキシカルボニルのような「カルボニルオキシアルキルオキシカルボニル基」を挙げることができ、そのような誘導体か否かは、ラットやマウスのような実験動物に静脈注射により投与し、その後の動物の体液を調べ、元となる化合物又はその薬理学的に許容される塩を検出できることにより決定できる。このようなヒドロキシ基の保護基として、好適には、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基又はシリル基

である。

上記「ヒドロキシ基の保護基」として、特に好適には、アセチル基又は *t*-ブチルジメチルシリル基である。

$R^{10}$  及び  $R^{11}$  の定義における「リン酸基の保護基」は、例えば、メチル、エチル、イソプロピル、ブチルのような低級アルキル基、2-シアノエチル、2-シアノ-1, 1-ジメチルエチルのようなシアノ基で置換された低級アルキル基、

2-(メチルジフェニルシリル)エチル、2-トリメチルシリルエチルのような低級アルキル又は低級アルキルとアリールとでトリ置換されたシリル基で置換された低級アルキル基、

2-(2'-ピリジル)エチル、2-(4'-ピリジル)エチルのようなヘテロシクリルで置換された低級アルキル基、

2-フェニルチオエチル、2-(4'-ニトロフェニルチオ)エチル、2-(4'-トリフェニルメチルフェニルチオ)エチルのようなアリールチオで置換された低級アルキル基

2-(*t*-ブチルスルホニル)エチル、2-(フェニルスルホニル)エチル、2-(ベンジルスルホニル)エチルのようなアルキルスルホニル、アリールスルホニル又はアリールアルキルスルホニルで置換された低級アルキル基、

2, 2, 2-トリクロロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル-1, 1-ジメチルエチル、2, 2, 2-トリブromoエチル、2, 3-ジブromoプロピル、2, 2, 2-トリフルオロエチルのようなハロゲン低級アルキル基；

ベンジル、フェネチル、3-フェニルプロピル、 $\alpha$ -ナフチルメチル、 $\beta$ -ナフチルメチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、9-アンスリルメチルのような1～3個のアリール基で置換された低級アルキル基、*o*-ニトロベンジル、4-ニトロベン



ジル、2, 4-ジニトロベンジル、4-クロロベンジル、4-クロロ-2-ニトロベンジル、4-アシルオキシベンジルのようなニトロ、ハロまたは低級脂肪族アシルでアリール環が置換されたアリール基で置換された低級アルキル基、2-ニトロフェニルエチルのような置換基を有するアリール基で置換された低級アルキル基、9-フルオレニルメチルのようなフルオレニル基で置換された低級アルキル基などのアラルキル類；

アリル、プロペニルのような低級アルケニル基；

4-シアノ-2-ブテニルのようなシアノで置換された低級アルケニル基；

フェニルのようなアリール基；

2-メチルフェニル、2, 6-ジメチルフェニル、2-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2-ブロモフェニル、4-ニトロフェニル、3, 5-ジニトロフェニル、4-クロロ-2-ニトロフェニル、2-メトキシ-5-ニトロフェニルのような低級アルキル、アリール基でトリ置換された低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ又はハロで置換されたアリール基；

並びに

アニリデイト、4-トリフェニルメチルアニリデイト、[N-(2-トリチロキシ)エチル]アニリデイト、p-(N, N-ジメチルアミノ)アニリデイト、3-(N, N-ジエチルアミノメチル)アニリデイトのようなアミド類

である。

「リン酸基の保護基」は、好適には、低級アルキル基、低級アルケニル基または1乃至3個のフェニル若しくはナフチルで置換されたメチル基であり、更に好適には、メチル基、エチル基、アリル基またはベンジル基であり、最も好適には、メチル基又はエチル基である。

上記において、 $R^5$ の定義における「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基」の具体例は、例えば、2-フルオロシクロプロピル、2-クロロシクロプロピル、2-若しくは3-フルオロシクロペンチル、2-若しくは3-クロロシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-フルオロシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-クロロシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-ブロモシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-ヨードシクロヘキシル、2-メチルシクロプロピル、2-エチルシクロプロピル、2-若しくは3-メチルシクロペンチル、2-若しくは3-エチルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-メチルシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-エチルシクロヘキシル、2-トリフルオロメチルシクロプロピル、2-若しくは3-トリフルオロメチルシクロブチル、2-若しくは3-トリフルオロメチルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、2-メトキシシクロプロピル、2-若しくは3-メトキシシクロブチル、2-若しくは3-メトキシシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-メトキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-エトキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-プロポキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-イソプロポキシシクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-(1-エチルプロポキシ)シクロヘキシル、2-, 3-若しくは4-(2-エチルプロポキシ)シクロヘキシル、2-カルボキシシクロプロピル、2-若しくは3-カルボキシシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-カルボキシシクロヘキシル、2-メトキシカルボニルシクロプロピル、2-若しくは3-メトキシカルボニルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-メトキシカルボニルシクロヘキシル、2-ヒドロキシシクロプロピル、2-若しくは3-ヒドロキシシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-ヒドロキシシクロヘキシル、2-ホルミルシクロプロピル、2-若しくは3-ホルミルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-ホルミルシクロヘキシル、2-アセチルシクロプロピル、2-若しくは3-アセチルシクロペンチル、2-,

3-若しくは4-アセチルシクロヘキシル、2-アミノシクロプロピル、2-若しくは3-アミノシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-アミノシクロヘキシル、2-メチルアミノシクロプロピル、2-若しくは3-メチルアミノシクロブチル、2-若しくは3-メチルアミノシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-メチルアミノシクロヘキシル、2-ジメチルアミノシクロプロピル、2-若しくは3-ジメチルアミノシクロブチル、2-若しくは3-ジメチルアミノシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-ジメチルアミノシクロヘキシル、2-シアノシクロプロピル、2-若しくは3-シアノシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-シアノシクロヘキシル、2-若しくは3-シクロヘキシルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-シクロヘキシルシクロヘキシル、2-フェニルシクロプロピル、2-若しくは3-フェニルシクロペンチル、2-, 3-若しくは4-フェニルシクロヘキシル、3, 4-ジフルオロシクロヘキシル、3, 4-ジクロロシクロヘキシル、2, 3-ジメトキシシクロヘキシル、3, 4-ジメトキシシクロヘキシル、3, 5-ジメトキシシクロヘキシル、3, 4, 5-トリメトキシシクロヘキシル基であり得、好適には、1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、更に好適には、1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、より更に好適には、1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロヘキシル基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、最も好適には、1個置換されたシクロヘキシル基（該置換基は、フッ素原子、塩素原子、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ及びアセチル基から成る群から選択される基である。）で

ある。

R<sup>5</sup>の定義における「置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> アリール基」の具体例は、例えば、2-、3-若しくは 4-フルオロフェニル、2-、3-若しくは 4-クロロフェニル、2-、3-若しくは 4-ブロモフェニル、2-、3-若しくは 4-ヨードフェニル、2-、3-若しくは 4-メチルフェニル、2-、3-若しくは 4-エチルフェニル、2-、3-若しくは 4-プロピルフェニル、2-、3-若しくは 4-ブチルフェニル、2-、3-若しくは 4-ペンチルフェニル、2-、3-若しくは 4-トリフルオロメチルフェニル、2-、3-若しくは 4-メトキシフェニル、2-、3-若しくは 4-エトキシフェニル、2-、3-若しくは 4-プロポキシフェニル、2-、3-若しくは 4-イソプロポキシフェニル、2-、3-若しくは 4-ブトキシフェニル、2-、3-若しくは 4-(1-エチルプロポキシ)フェニル、2-、3-若しくは 4-(2-エチルプロポキシ)フェニル、2-、3-若しくは 4-メチルチオフェニル、2-、3-若しくは 4-エチルチオフェニル、2-、3-若しくは 4-カルボキシフェニル、2-、3-若しくは 4-メトキシカルボニルフェニル、2-、3-若しくは 4-エトキシカルボニルフェニル、2-、3-若しくは 4-ヒドロキシフェニル、2-、3-若しくは 4-ホルミルフェニル、2-、3-若しくは 4-アセチルフェニル、2-、3-若しくは 4-アミノフェニル、2-、3-若しくは 4-メチルアミノフェニル、2-、3-若しくは 4-ジメチルアミノフェニル、2-、3-若しくは 4-シアノフェニル、2-、3-若しくは 4-シクロペンチルフェニル、2-、3-若しくは 4-シクロヘキシルフェニル、2-、3-若しくは 4-ビフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジブロモフェニル、2, 3-ジメチルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 5-

ージメチルフェニル、2, 3ージメトキシフェニル、3, 4ージメトキシフェニル、3, 5ージメトキシフェニル、3, 4, 5ートリメトキシフェニル、3ーフルオロー4ーメトキシフェニル、4ーメチルー2ーメトキシフェニル、6ーフルオロー4ーメチルー2ーメトキシフェニル、5ーフルオロインデンー3ーイル、5ーフルオロインデンー3ーイル、5ーメチルインデンー3ーイル、5ーメトキシインデンー3ーイル、5ーフルオロインデンー2ーイル、5ークロロインデンー2ーイル、5ーメチルインデンー2ーイル、5ーメトキシインデンー2ーイル、5ーヒドロキシインデンー3ーイル、5ーニトロインデンー3ーイル、5ーシクロヘキシルインデンー3ーイル、5ーフェニルインデンー3ーイル、5ーフェノキシインデンー3ーイル、5ーベンジルオキシインデンー3ーイル、5ーフェニルチオインデンー3ーイル、5ーヒドロキシインデンー2ーイル、5ーニトロインデンー2ーイル、5ーシクロヘキシルインデンー2ーイル、5ーフェニルインデンー2ーイル、5ーフルオロナフタレンー2ーイル、5ーフルオロナフタレンー2ーイル、5ーメチルナフタレンー2ーイル、5ーメトキシナフタレンー2ーイル、5ーフルオロナフタレンー1ーイル、5ーフルオロナフタレンー1ーイル、5ーメチルナフタレンー1ーイル、5ーメトキシナフタレンー1ーイル、5ーヒドロキシナフタレンー2ーイル、5ーニトロナフタレンー2ーイル、5ーシクロヘキシルナフタレンー2ーイル、5ーフェニルナフタレンー2ーイル、5ーフェノキシナフタレンー2ーイル、5ーベンジルオキシナフタレンー2ーイル、5ーフェニルチオナフタレンー2ーイル、5ーヒドロキシナフタレンー1ーイル、5ーニトロナフタレンー1ーイル、5ーシクロヘキシルナフタレンー1ーイル、5ーフェニルナフタレンー1ーイル基であり得、好適には、1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>ーC<sub>10</sub>アリール基（該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。）であり、更に好適には、1乃至3個置換されたC<sub>6</sub>ーC<sub>10</sub>アリール基（該置換基は、ハロ

ゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。)であり、より更に好適には、1乃至3個置換されたフェニル基(該置換基は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級脂肪族アシル基から成る群から選択される基である。)であり、更により好適には、1乃至2個置換されたフェニル基(該置換基は、フッ素原子、塩素原子、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ及びアセチル基から成る群から選択される基である。但し、メトキシ基については、1乃至3個置換されたフェニル基が好ましい。)であり、最も好適には、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,5-ジメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3,4-ジトリフルオロメチルフェニル、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,5-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、3-アセチルフェニル又は4-アセチルフェニル基である。

R<sup>5</sup>の定義における「置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基」の具体例は、例えば、3-,4-若しくは5-メチルフラン-2-イル、2-,4-若しくは5-メチルフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-フルオロチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-フルオロフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-ブロモチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-ブロモフラン-3-イル、3-,4-若しくは5-メチルチオフェン-2-イル、2-,4-若しくは5-

メチルチオフェン-3-イル、3-, 4-若しくは5-エチルチオフェン-2-イル、2-, 4-若しくは5-エチルチオフェン-3-イル、3-, 4-若しくは5-メトキシチオフェン-2-イル、2-, 4-若しくは5-メトキシチオフェン-3-イル、3-若しくは4-メチルチアゾール-5-イル、3-, 4-若しくは5-フルオロベンゾチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-ブロモベンゾチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メチルベンゾチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-メトキシベンゾチオフェン-2-イル、2-, 4-若しくは5-フルオロベンゾチオフェン-3-イル、2-, 4-若しくは5-ブロモベンゾチオフェン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メチルベンゾチオフェン-3-イル、2-, 4-若しくは5-メトキシベンゾチオフェン-3-イル、4-, 5-, 6-若しくは7-メチルベンゾチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-ヒドロキシフラン-2-イル、2-, 4-若しくは5-ヒドロキシフラン-3-イル、3-, 4-若しくは5-ヒドロキシチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-ニトロチオフェン-2-イル、3-, 4-若しくは5-フェニルチオフェン-2-イル、2-, 4-若しくは5-ヒドロキシチオフェン-3-イル、2-, 4-若しくは5-シアノチオフェン-3-イル、1-, 2-若しくは3-ヒドロキシピリジン-4-イル、1-, 2-若しくは3-シアノピリジン-4-イル、1-, 2-若しくは3-フェニルピリジン-4-イル基であり得、好適には、3-, 4-若しくは5-フルオロチオフェン-2-イル又は2-, 4-若しくは5-フルオロフラン-3-イル基である。

「その薬理上許容される塩」とは、本発明の一般式 (I)、(II) 又は (III) を有する化合物は、アミノ基のような塩基性の基を有する場合には酸と反応させることにより、又、カルボキシ基若しくはリン酸基のような酸性基を有する場合には塩基と反応させることにより、塩にすることができるので、その塩を示す。

塩基性の基に基づく塩は、例えば、フッ化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩、硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルカンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなアリールスルホン酸塩、酢酸塩、リンゴ酸塩、フマル酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩等の有機酸塩；又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり得、好適には、有機酸塩（特に、フマル酸塩、シュウ酸塩若しくはマレイン酸塩）又はハロゲン化水素酸塩（特に、塩酸塩）である。

一方、酸性の基に基づく塩は、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、リチウム塩のようなアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩、アルミニウム塩、鉄塩等の金属塩；アンモニウム塩のような無機塩、*t*-オクチルアミン塩、ジベンジルアミン塩、モルホリン塩、グルコサミン塩、フェニルグリシンアルキルエステル塩、エチレンジアミン塩、N-メチルグルカミン塩、グアニジン塩、ジエチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、N, N'-ジベンジルエチレンジアミン塩、クロロプロカイン塩、プロカイン塩、ジエタノールアミン塩、N-ベンジルフェネチルアミン塩、ピペラジン塩、テトラメチルアンモニウム塩、トリス（ヒドロキシメチル）アミノメタン塩のような有機塩等のアミン塩；又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり得、好適には、アルカリ金属塩（特に、ナトリウム塩）である。

本発明の一般式（I）、（II）又は（III）を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、大気中に放置したり、又は、再結晶をすることにより、水分を吸収し、吸着水が付いたり、水



和物となる場合があり、そのような水和物も本発明の塩に包含される。

本発明の一般式 (I)、(II) 又は (III) を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、その分子内に不斉炭素原子を有するので、光学異性体が存在する。本発明の化合物においては、光学異性体および光学異性体の混合物がすべて単一の式、即ち一般式 (I)、(II) 又は (III) で示されている。従って、本発明は光学異性体および光学異性体の任意の割合の混合物をもすべて含むものである。

本発明の一般式 (I)、(II) 又は (III) を有する化合物は、好適には、式  $-NR^1R^2$  を有する基が結合している不斉炭素原子に関して、R の絶対配位を有する化合物である。

上記における「エステル」とは、本発明の化合物 (I)、(II) 又は (III) は、エステルにすることができるので、そのエステルをいい、そのようなエステルは、「ヒドロキシ基のエステル」及び「カルボキシ基のエステル」であり、各々のエステル残基が「反応における一般的保護基」又は「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」であるエステルをいう。

「反応における一般的保護基」とは、加水素分解、加水分解、電気分解、光分解のような化学的方法により開裂し得る保護基をいう。

「ヒドロキシ基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」及び「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」としては、前記「ヒドロキシ基の保護基」と同意義を示す。

「カルボキシ基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」は、好適には、前記「低級アルキル基」；エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-エチル-2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、1-メチル-2-ブ

テニル、1-メチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニルのような低級アルケニル基；エチニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-2-プロピニル、2-エチル-2-プロピニル、2-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-2-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-ペンチニル、1-メチル-2-ペンチニル、2-メチル-2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニルのような低級アルキニル基；前記「ハロゲノ低級アルキル」；2-ヒドロキシエチル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、3-ヒドロキシプロピル、3, 4-ジヒドロキシブチル、4-ヒドロキシブチルのようなヒドロキシ「低級アルキル基」；アセチルメチルのような「低級脂肪族アシル」-「低級アルキル基」；前記「アラルキル基」；又は前記「シリル基」である。

「カルボキシ基のエステル」に斯かる「生体内で加水分解のような生物学的な方法により開裂し得る保護基」は、好適には、メトキシエチル、1-エトキシエチル、1-メチル-1-メトキシエチル、1-（イソプロポキシ）エチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、1, 1-ジメチル-1-メトキシエチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、n-ブトキシメチル、t-ブトキシメチルのような低

級アルコキシ低級アルキル基、2-メトキシエトキシメチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシ低級アルキル基、フェノキシメチルのような「アリール」オキシ「低級アルキル基」、2, 2, 2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲン化低級アルコキシ低級アルキル基等の「アルコキシアルキル基」；メトキシカルボニルメチルのような「低級アルコキシ」カルボニル「低級アルキル基」；シアノメチル、2-シアノエチルのような「シアノ」低級アルキル基」；メチルチオメチル、エチルチオメチルのような「低級アルキル」チオメチル基」；フェニルチオメチル、ナフチルチオメチルのような「アリール」チオメチル基」；2-メタンスルホニルエチル、2-トリフルオロメタンスルホニルエチルのような「ハロゲンで置換されていてもよい「低級アルキル」スルホニル「低級アルキル基」」；2-ベンゼンスルホニルエチル、2-トルエンスルホニルエチルのような「アリール」スルホニル「低級アルキル基」」；前記「1-(アシルオキシ)「低級アルキル基」」；前記「フタリジル基」；前記「アリール基」；前記「低級アルキル基」；カルボキシメチルのような「カルボキシアルキル基」；又はフェニルアラニンのような「アミノ酸のアミド形成残基」である。

上記「カルボキシ基のエステル」に斯かる「反応における一般的保護基」及び「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」において、更に好適には、低級アルキル又はアラルキル基である。

本発明の医薬組成物の有効成分である「免疫抑制剤」は、免疫反応の進行を防止あるいは阻害する薬剤であり、免疫抑制作用を有する化合物で、作用機序に基づき、以下の群に分類される。

(1) T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤であり、細胞内シグナルの伝達を阻害することにより、サイトカインの産生を阻害するようなもの、及びサイトカインシグナルが免疫細胞に作用するのを阻害するものが含まれる。そのようなT細胞

胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤としては、例えば、

US 4, 117, 118号公報にS 7 4 8 1/F-1として記載される化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、サイクロスポリン A (cyclosporin A) であり、その化学名は、シクロ[3-ヒドロキシ-4-メチル-2-(メチルアミノ)-6-オクテノイル]-2-アミノブチリル-メチルグリシル-メチル-ロイシル-バリル-メチル-ロイシル-アラニル-アラニル-メチル-ロイシル-メチル-ロイシル-メチル-バリルである。〕、

EP 1 8 4, 1 6 2号公報に記載された一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、タクロリムス(tacrolimus)であり、その化学名は、17-アリル-1, 14-ジヒドロキシ-12-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシシクロヘキシル)-1-メチルビニル]-23, 25-ジメトキシ-13, 19, 21, 27-テトラメチル-11, 28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[2.2.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2, 3, 10, 16-テトロンである。〕、

US 3, 929, 992号公報にラパマイシン(rapamycin)として記載される化合物〔その化学名は、9, 10, 12, 13, 14, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 32, 33, 34, 34a-ヘキサデカヒドロ-9, 27-ジヒドロキシ-3-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシシクロヘキシル)-1-メチルエチル]-10, 21-ジメトキシ-6, 8, 12, 14, 20, 26-ヘキサメチル-23, 27-エポキシ-3H-ピリド[2, 1-c][1, 4]オキサアザシクロヘントリアコンチン-1, 5, 11, 28, 29(4H, 6H, 31H)-ペントンである。〕、

EP 9 4, 6 3 2号公報(特開昭58-62152号公報)に記載された一般式(II)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、グスペリムス(gusperimus)であり、その化学名は、N-[4-(3-アミノプロピル)アミノブチル]カルバモイルヒドロキシメチル-7-グア

ニジノヘプタンアミドであり、本発明のグスペリムスはその薬理上許容される塩（塩酸塩）も含有する。]、

US 5, 912, 253号公報に記載された式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、エベロリムス（everolimus）であり、その化学名は、9, 10, 12, 13, 14, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 32, 33, 34, 34a-ヘキサデカヒドロ-9, 27-ジヒドロキシー-3-[2-[4-ヒドロキシエトキシ-3-メトキシシクロヘキシル]-1-メチルエチル]-10, 21-ジメトキシ-6, 8, 12, 14, 20, 26-ヘキサメチル-23, 27-エポキシ-3H-ピリド[2, 1-c][1, 4]アザシクロヘントリアコンチン-1, 5, 11, 28, 29(4H, 6H, 31H)-ペントンである。}、

EP 600, 762号公報に記載された式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、トレスペリムス（tresperimus）であり、その化学名は、2-[4-(3-アミノプロピルアミノ)ブチル]アミノカルボニルオキシ-N-[6-(アミノイミノメチルアミノヘキシル)アセトアミド]であり、本発明のトレスペリムスはその薬理上許容される塩も含有する。]、

Int. J. Immunopharmacol., vol. 21(5), 349-358(1999)に LF15-0195として記載される化合物{アニスペリムス（anisperimus）とも呼ばれ、その化学名は、[(6-グアニジノヘキシル)カルバモイル]メチル[4-(3-アミノブチル)アミノブチル]カルバメートである。}、

EP 626, 385号公報（特許3076724号公報又は米国特許第5, 493, 019号公報）に記載された一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、SDZ-281-240であり、その化学名は、17-エチル-1, 14-ジヒドロキシー-12-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシシクロヘキシル)-1-メチルビニル]-23, 25-ジメトキシ-13, 19, 21, 27-テトラメチル-11,

28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[22.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2,3,10,16-テトロンであり、本発明のSDZ-281-240はその薬理上許容される塩も含有する。)、

WO93/04680号公報(EP642,516号公報)に記載された一般式(VII)を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、ABT-281であり、その化学名は、17-エチル-1,14-ジヒドロキシ-12-[2-(4-テトラゾリル-3-メトキシシクロヘキシル)-1-メチルビニル]-23,25-ジメトキシ-13,19,21,27-テトラメチル-11,28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[22.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2,3,10,16-テトロンである。}、

EP414,632号公報に記載された一般式(A)を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、チグデリムスであり、その化学名は、シクロ[[3-ヒドロキシ-4-メチル-2-(メチルアミノ)-6-オクテノイル]-L-2-アミノブチリル-N-メチルグリシル-N-メチル-L-ロイシル-L-バリル-N-メチル-L-ロイシル-L-アラニル-[3-O-(2-ヒドロキシエチル)-D-セリル]-N-メチル-L-ロイシル-N-メチル-L-ロイシル-N-メチル-L-バリル]である。}、

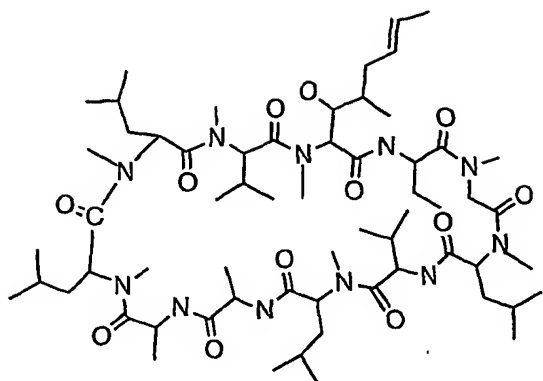
WO97/11080号公報に記載された一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、A-119435であり、その化学名は、17-エチル-1,14-ジヒドロキシ-12-[2-[4-(アセチルアミノアセチルチオ)-3-メトキシシクロヘキシル]-1-メチルビニル]-23,25-ジメトキシ-13,19,21,27-テトラメチル-11,28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[22.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2,3,10,16-テトロンである。}、又は

Bioorg. Med. Chem. Lett., vol. 9(2), 227-232(1999)

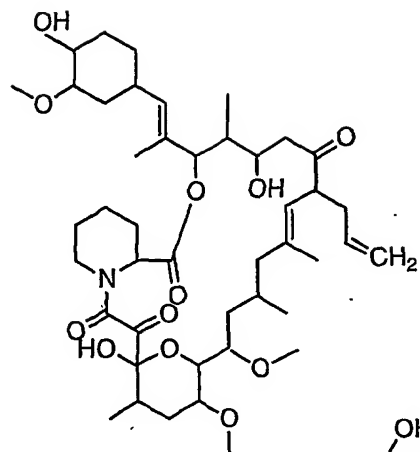
に記載された 17-エチル-1, 14-ジヒドロキシ-12-[2-[4-(2-フェニルヒドラジノカルボニルオキシ)-3-メトキシシクロヘキシル]-1-メチルビニル]-23, 25-ジメトキシ-13, 19, 21, 27-テトラメチル-11, 28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[2.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2, 3, 10, 16-テトロン

を挙げることができる。

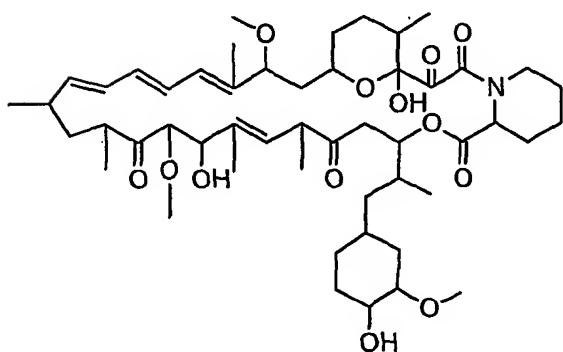
次に、代表的化合物の平面式を示す。



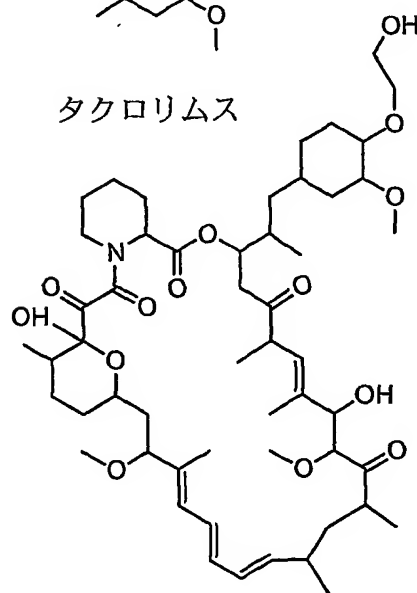
サイクロスポリンA



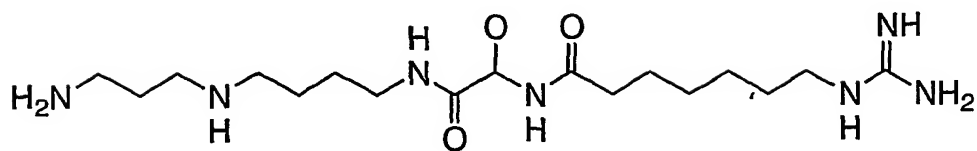
タクロリムス



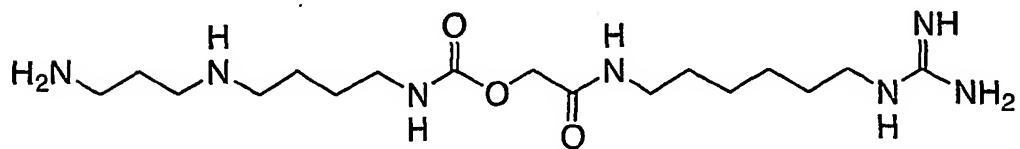
ラパマイシン



エベロリムス

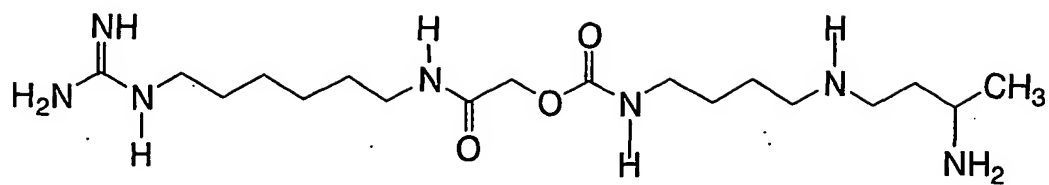


グスペリムス

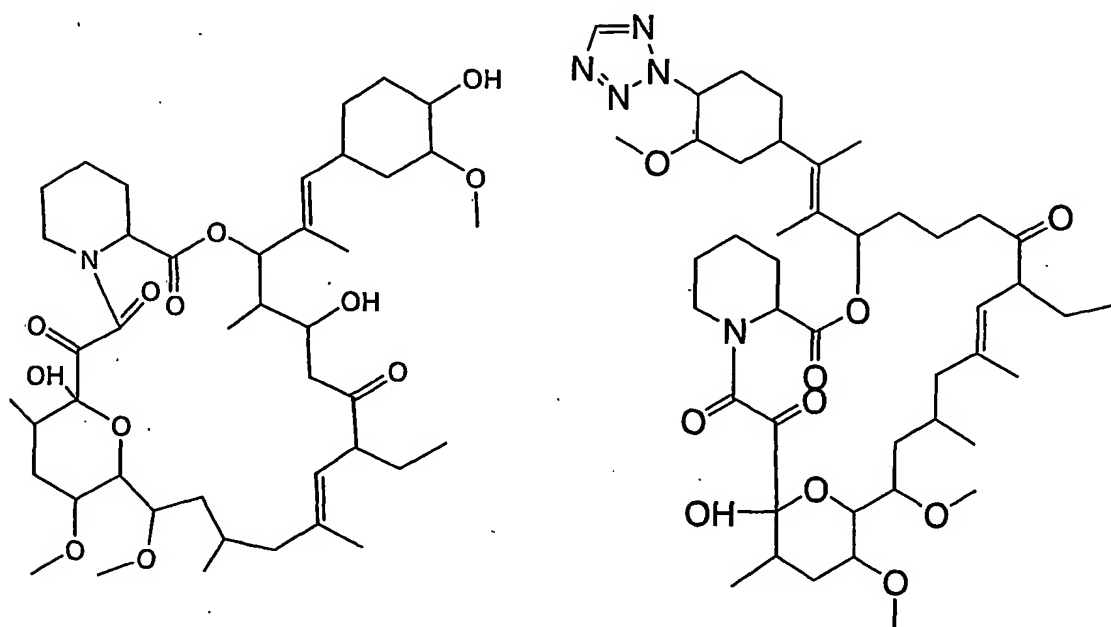


トレスペリムス



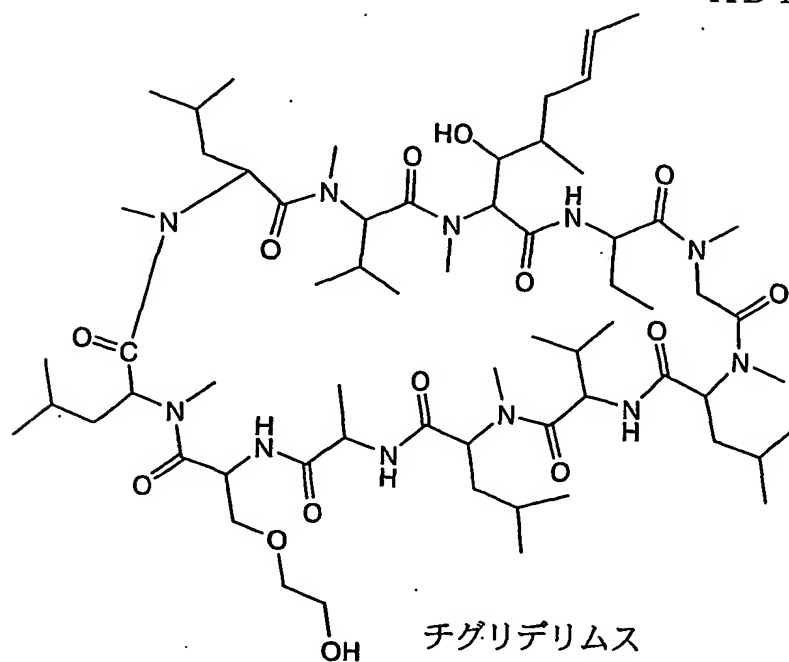


アニスペリムス

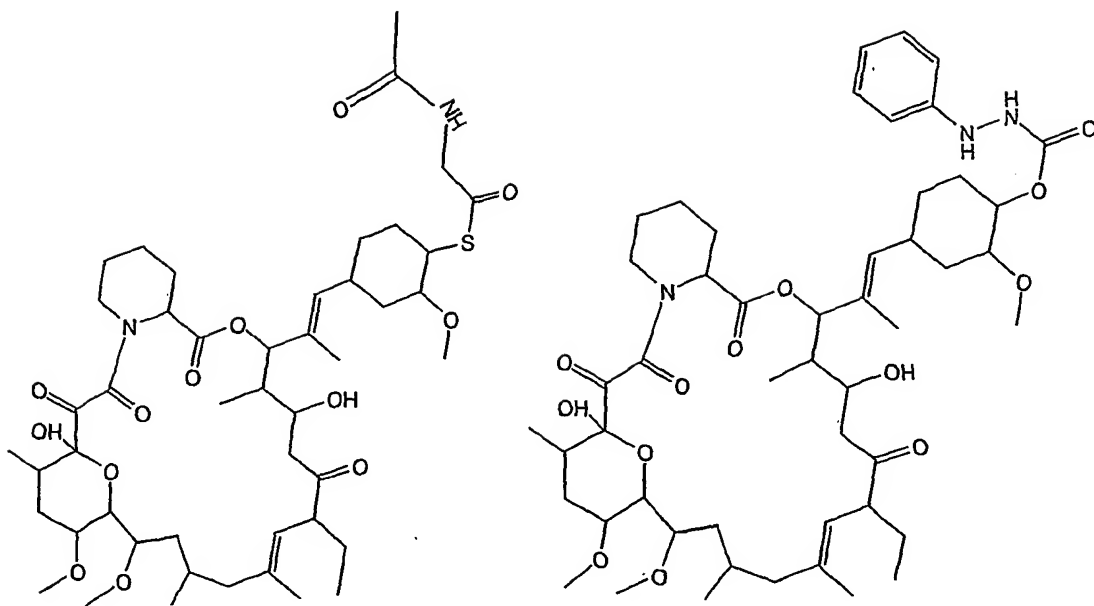


SDZ-281-240

ABT-281



チグリデリムス



A-119435

17-エチル-1,14-ジヒドロキシ-12- [2-  
[4-(2-フェニルヒドラジノカルボニルオキシ-  
3-メトキシシクロヘキシル)]-1-  
メチルビニル]-23,25-ジメトキシ-  
13,19,21,27-テトラメチル-11,28-  
ジオキサ-4-アザトリシクロ[22.3.1.0<sup>4,9</sup>]  
オクタコス-18-エン-2,3,10,16-テトロン

(2) 免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤であり、免疫細胞中でヌクレオシド合成を阻害することにより、リンパ球の増殖を抑制し、非特異的な免疫抑制作用を示す。そのような免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤としては、例えば、

US 3, 888, 843号公報の請求項1に記載された化学構造式を有する化合物(ミゾリビンであり、その化学名は、5-ヒドロキシ-1-β-D-リボフラノシル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミドである。)、

US 3, 056, 785号公報の請求項7に記載された一般式を有する化合物又はその薬理上許容される塩[好適には、アザチオプリンであり、その化学名は、6-[(1-メチル-4-ニトロ-1H-イミダゾール-5-イル)チオ]-1H-プリンであり、本発明のアザチオプリンには、その

薬理上許容される塩（塩酸塩）も含まれる。]、

EP 2 8 1, 7 1 3 号公報（US 4, 7 5 3, 9 3 5 号公報）に記載された一般式（A）を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、ミコフェノール酸であり、その化学名は、6-（1, 3-ジヒドロ-4-ヒドロキシ-6-メトキシ-7-メチル-3-オキソ-5-イソベンゾフラニル）-4-メチル-（4E）-ヘキセン酸 2-（4-モルフォリニル）エチル エステルである。〕、

EP 1 3 3 7 6 号公報（特開昭 6 2 - 7 2 6 1 4 号公報又はUS 4, 2 8 4, 7 8 6 号公報）に記載された式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、レフルノマイドであり、その化学名は、5-メチル-N-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕-4-イソオキサゾールカルボキサミドである。〕、

WO 9 7 / 4 0 0 2 8 号公報に記載された一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、メリメンポディブ（merimempodib）であり、その化学名は、[[3-[[[3-メトキシ-4-（5-オキサゾリル）フェニル]アミノ]カルボニル]アミノ]フェニル]メチル]カルバミン酸（3s）-テトラヒドロ-3-フラニル エステルである。〕、

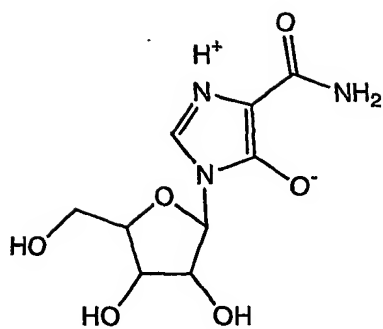
FR 2, 7 2 7, 6 2 8 号公報に記載された一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、HMR-1 2 7 9 であり、その化学名は、 $\alpha$ -シアノ-N-（4-シアノフェニル）- $\beta$ -オキソ-シクロプロパンプロパンアミドである。〕、

WO 9 3 / 2 2 2 8 6 号公報（日本特許 2 9 2 8 3 8 5 号公報、EP 6 0 1 1 9 1 号公報又はUS 5, 3 7 1, 2 2 5 号公報）に記載された一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、TSK-2 0 4 であり、その化学名は、6, 7-ジヒドロ-10-フルオロ-3-（2-フルオロフェニル）-5H-ベンゾ〔6, 7〕シクロヘプタ〔1, 2-b〕キノリン-8-カルボン酸である。〕、又は

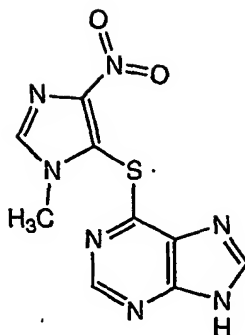
EP 569, 912号（公報特開平6-32784号公報）に記載された一般式（I）を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、SP-100030であり、その化学名は、2-クロロ-N-[3,5-ジ(トリフルオロメチル)フェニル]-4-(トリフルオロメチル)ピリミジン-5-カルボキシアミドである。}

を挙げることができる。

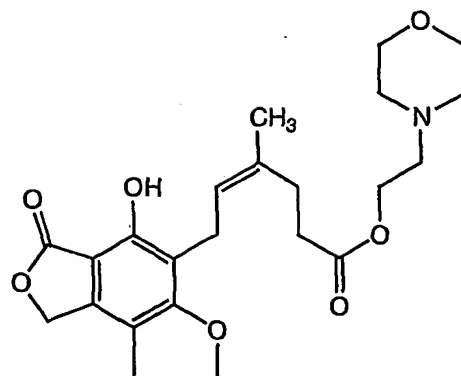
次に、代表的な化合物の平面式を示す。



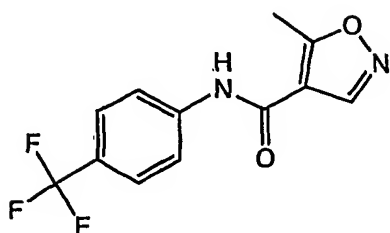
ミゾリビン



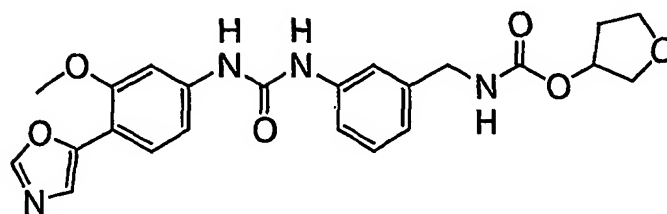
アザチオプリン



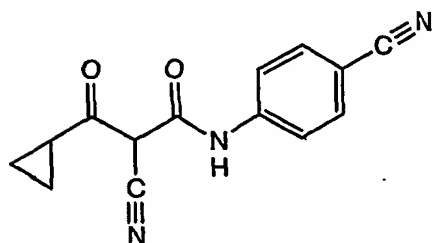
ミコフェノール酸



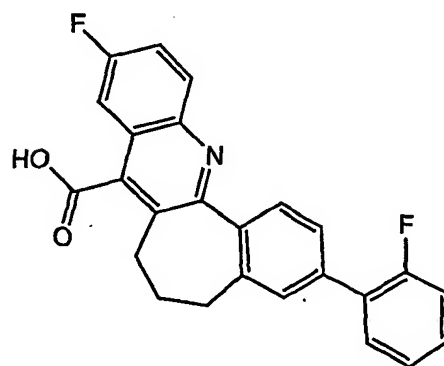
レフルノマイド



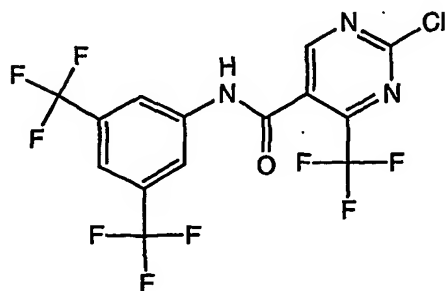
メリメンポディブ



HMR-1279



TSK-204



SP-100030

(3) 免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤であり、サイトカインの産生抑制の他にリンパ球増殖抑制や免疫グロブリン産生抑制作用を併せ持ち、さらに、該薬剤には、T細胞増殖抑制作用、NK細胞活性抑制、TNF受容体拮抗作用等も有する化合物も含まれる。そのような免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤としては、例えば、

特開平2-49778号公報の特許請求の範囲第(1)項に記載された一般式を有する化合物又はその薬理上許容される塩(好適には、T-614であり、その化学名は、N-[3-ホルミルアミノ-4-オキソ-6-フェノキシ-4H-1-ベンゾピラン-7-イル]メタンスルホンアミドである。)、

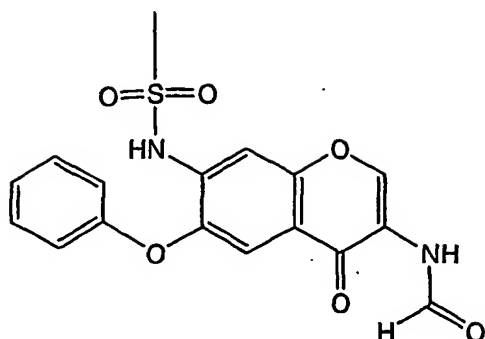
US 4, 720, 506号公報に記載された一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩[好適には、アクタリット(actarit)であり、その化学名は、4-(アセチルアミノ)ベンゼン酢酸である。]、

US 2, 396, 145号公報の特許請求の範囲第1項に記載される一般式を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、サラゾスルファピリジン(salazosulfapyridine)であり、その化学名は、5-[[p-(2-ピリジルスルファモイル)-フェニル]アゾ]サルチル酸である。}、又は

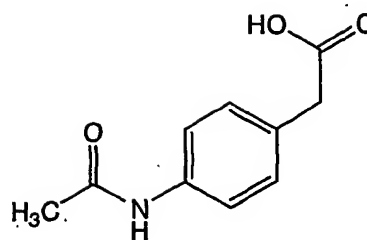
WO 97/23457号公報に記載された一般式(I)を有する化合物[好適には、CDC-801であり、その化学名は、3-フタルイミド-3-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)プロピオンアミドである。]

を挙げることができる。

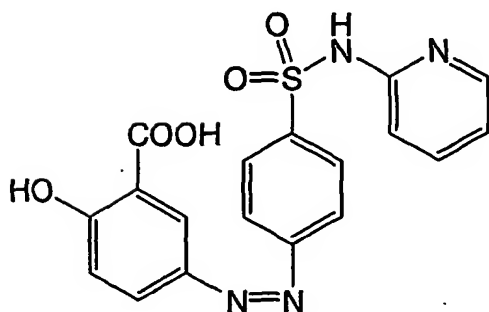
次に、代表的化合物の平面式を示す。



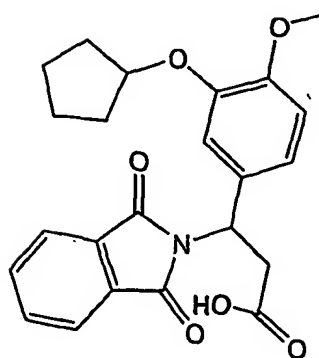
T-614



アクタリット



サラゾスルファピリジン

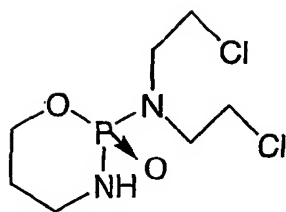


CDC-801

(4) DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキル化剤であり、このような薬剤としては、例えば、

US 3, 018, 302号公報に記載された一般式(IIIa)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、シクロフォスファミドであり、その化学名は、N, N'-ビス-(2-クロロエチル)テトラヒドロ-2H-1, 3, 2-オキサザホスフォリン-2-アミン 2-オキサイドである。〕

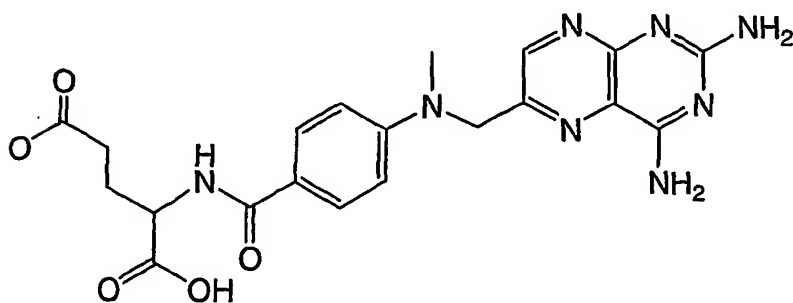
を挙げることができる。



シクロフォスファミド

(5) 葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤であり、ジヒドロ葉酸レダクターゼと結合し、核酸成分の合成に不可欠なテトラヒドロ葉酸産生を抑制することにより、核酸代謝を阻害する作用を有する。そのような葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤としては、例えば、

US 2, 512, 572号公報の請求項1に記載された一般式を有する化合物又はその薬理上許容される塩{好適には、メトトレキセートであり、その化学名は、N-[4-[[2, 4-ジアミノ-6-プテリジニル)メチル]メチルアミノ]ベンゾイル-L-グルタミン酸である。}を挙げることができる。



メトトレキセート

(6) TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤であり、この蛋白質製剤の群には、血中TNF- $\alpha$ の中和作用やそのレセプターを介した細胞内へのTNF- $\alpha$ シグナルを阻害することにより、TNF- $\alpha$ の作用を抑制する化合物並びにIL-1レセプターアンタゴニスト、可溶性IL-1レセプタ



ー及び抗IL-6レセプター抗体が含まれる。そのようなTNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤としては、例えば、

US 5, 656, 272号公報及び Drugs, vol. 59(6), 1341-1359 (2000)に記載されるレミケード (infliximab)、

WO 94/06, 476号公報、US 5, 605, 690号公報及び Expert. Opin. Pharmacother., July vol. 2(7), 1137-1148 (2001)に記載されるエンブレル (etanercept)、

WO 92/11018号公報、US 5, 530, 101号公報及び N. Engl. J. Med., vol. 338(3), 161-165 (1997)に記載されるダクリズマブ (daclizumab)、

EP 449, 769号公報及び Clin. Pharmacol. Ther., Vol. 64(1), 66-72 (1998)に記載されるバシリキシマブ (basiliximab)、

WO 89/07452号公報、US 5, 846, 534号公報及び J. Clin. Oncol., vol. 15(4), 1567-1574 (1997)に記載されるアルムツズマブ (alemtuzumab)、

US 5, 965, 709号公報及び Drugs vol. 61(2), 253-60 (2001)に記載されるオマリズマブ (omalizumab)、

EP 613, 944号公報及び J. Pharm. Sci., vol. 84(12), 1488-1489 (1995)に記載される BMS-188667、

Arthritis-Rheum. Vol. 37(9), Suppl., S295, (1994)に記載される CDP-571、

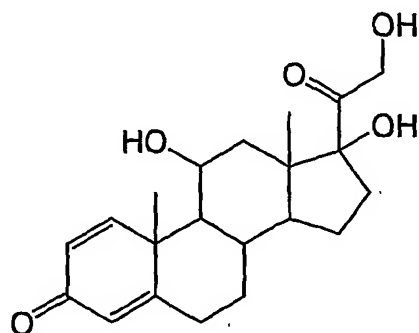
Transplant, June vol. 55, 1320-1327 (1993)に記載されるイノリモマブ (inolimomab)、

ATM-027及び

Blood, Dec 1, vol. 92(11), 4066-4071 (1998)に記載される BTI-322

を挙げることができる。

(7) 細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤であり、そのような薬剤として、例えば、プレドニゾロン（その化学名は、1，4-プレグナジエン-3，20-ジオン-11 $\beta$ ，17 $\alpha$ -21トリオールである。）を挙げることができる。



プレドニゾロン

(8) プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤であり、そのような薬剤として、例えば、

特公昭58-4699号公報の特許請求の範囲第1項に記載された一般式を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、ロキソプロフェンナトリウムであり、その化学名は、2-[4-(2-オキシシクロペンタン-1-イルメチル)フェニル]プロピオン酸ナトリウムである。〕、

US 3, 558, 690号公報に記載された一般式I(A)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、ジクロフェナックナトリウムであり、その化学名は、[o-(2, 6-ジクロロアニリノ)フェニル]酢酸ナトリウムである。〕、

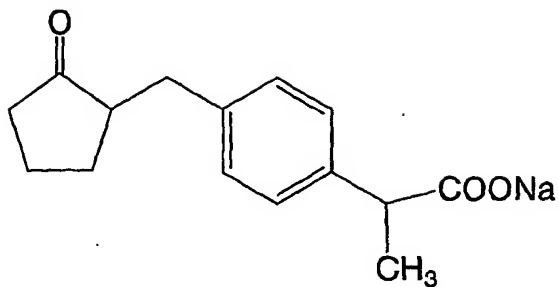
US 4, 233, 299号公報(EP 0, 002, 482号公報又は特開昭58-92976号公報)に記載された一般式(I)を有する化合物

又はその薬理上許容される塩〔好適には、メロキシカムであり、その化学名は、4-ヒドロキシ-2-メチル-N-(5-メチル-2-チアゾリル)-2H-1, 2-ベンゾチアジン-3-カルボキサミド-1, 1-ジオキサイドである。〕、

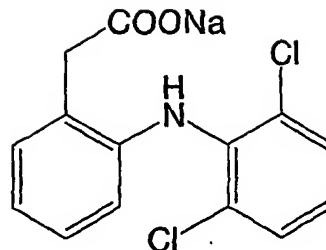
WO 95/15316号公報(US 5, 521, 207号公報又は特開2000-109466号公報)に記載された一般式(I I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、セレコキシブであり、その化学名は、4-[5-(4-メチルフェニル)-3-(トリフルオロメチル)ピラゾール-1-イル]ペンゼンスルホンアミドである。〕又は

WO 95/00501号公報(US 5, 474, 995号公報)に記載された一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩〔好適には、ロフェコキシブであり、その化学名は、4-[4-(メチルスルホニル)フェニル]-3-フェニル-2(5H)-フラノンである。〕

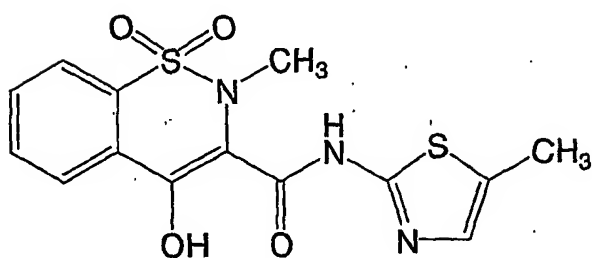
を挙げることができる。



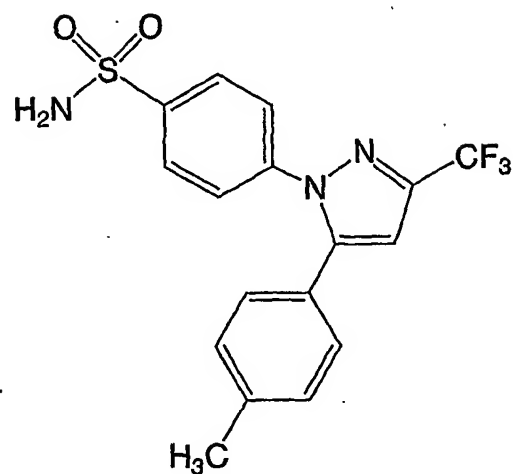
ロキソプロフェンナトリウム



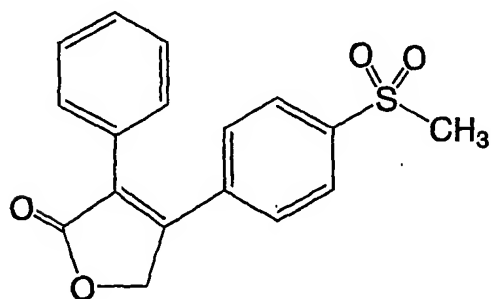
ジクロフェナックナトリウム



メロキシカム



セレコキシブ



ロフェコキシブ

上記免疫抑制剤において、さらに好適には、サイクロスポリンA、タクロリムス、ラパマイシン、レフルノマイド、メトトレキセート、レミケード及びエンブレルを挙げることができる。

上記における「薬理上許容される塩」は、上記免疫抑制剤が、アミノ基のような塩基性の基を有する場合には酸と反応させることにより、又、カ

ルボキシ基のような酸性基を有する場合には塩基と反応させることにより、得られる塩であり、以下の塩を包含する。

塩基性の基に基づく塩は、好適には、フッ化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩、硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルカンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなアリースルホン酸塩、酢酸塩、リンゴ酸塩、フマル酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩等の有機酸塩；及び、グリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり、更に好適には、塩酸塩、酢酸塩、フマル酸塩、コハク酸塩又はマレイン酸塩である。

一方、酸性の基に基づく塩は、好適には、ナトリウム塩、カリウム塩、リチウム塩のようなアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩、アルミニウム塩、鉄塩等の金属塩；アンモニウム塩のような無機塩、t-オクチルアミン塩、ジベンジルアミン塩、モルホリン塩、グルコサミン塩、フェニルグリシンアルキルエステル塩、エチレンジアミン塩、N-メチルグルカミン塩、グアニジン塩、ジエチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、N, N'-ジベンジリエチレンジアミン塩、クロロプロカイン塩、プロカイン塩、ジエタノールアミン塩、N-ベンジルフエネチルアミン塩、ピペラジン塩、テトラメチルアンモニウム塩、トリス（ヒドロキシメチル）アミノメタン塩のような有機塩等のアミン塩；及び、グリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩であり、更に好適には、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩又はアルミニウム塩である。

本発明の医薬組成物の有効成分である免疫抑制剤は、大気中に放置したり、又は、再結晶をすることにより、水分を吸収し、吸着水が付いたり、水和物となる場合があり、そのような水和物も本発明の塩に包含される。

本発明の医薬組成物の有効成分である免疫抑制剤は、その分子内に不斉炭素原子が存在する場合、種々の異性体を有する。本発明の化合物においては、これらの異性体およびこれらの異性体の混合物がすべて単一の式で示されている。従って、本発明はこれらの異性体およびこれらの異性体の任意の割合の混合物をもすべて含むものである。

本発明の一般式 (I)、(II) 又は (III) を有する化合物の具体例としては、例えば、下記表 1、表 2、表 3、表 4、表 5 及び表 6 に記載の化合物を挙げることができるが、本発明は、これらの化合物に限定されるものではない。なお、表 1 及び表 2 で同一の化合物番号で表される化合物は、X が S、O 又は  $N-CH_3$  の 3 つの化合物を、表 5 及び表 6 で同一の化合物番号で表される化合物は、X が S、O 又は  $N-CH_3$  であり、リン酸基が O 又は  $CH_2$  に結合する 6 つの化合物を示す。

表中の略号は以下の通りである。

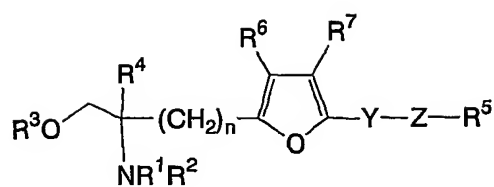
B u	:	ブチル基
i B u	:	イソブチル基
B z	:	ベンジル基
E t	:	エチル基
c H x	:	シクロヘキシル基
M e	:	メチル基
N p (1)	:	ナフタレン-1-イル基
N p (2)	:	ナフタレン-2-イル基
P h	:	フェニル基
c P n	:	シクロペンチル基
P r	:	プロピル基

i P r

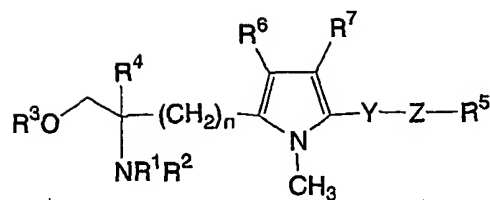
:

イソプロピル基。

表 1

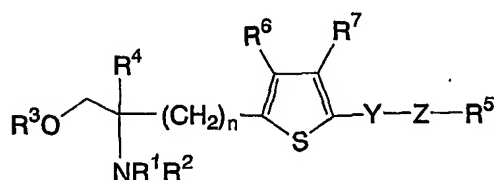


(Ia-1)



(Ia-2)

又は



(Ia-3)

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
1- 1	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1- 2	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1- 3	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1- 4	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1- 5	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1- 6	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1- 7	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1- 8	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1- 9	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-10	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-11	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-12	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H



1-13	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-14	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-15	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-16	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-17	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-18	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-19	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-20	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-21	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
1-22	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-23	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-24	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-25	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-26	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-27	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-28	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-29	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-30	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-31	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
1-32	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-33	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-34	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-35	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-36	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-37	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-38	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-39	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-40	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-41	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cPn}$	H	H

1-42	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H
1-43	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	Me	H
1-44	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	Me
1-45	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	F	H
1-46	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	F
1-47	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-48	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-49	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-50	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-51	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-52	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-53	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-54	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-55	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-56	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-57	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
1-58	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-59	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-60	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-61	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-62	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-63	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-64	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-65	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-66	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-67	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-68	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-69	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-70	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H

1-71	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-[4-(2-Et-PrO)-cHx]$	H	H
1-72	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-iBuO-cHx)$	H	H
1-73	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iBuO-cHx)$	H	H
1-74	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-MeS-cHx)$	H	H
1-75	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeS-cHx)$	H	H
1-76	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-EtS-cHx)$	H	H
1-77	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-EtS-cHx)$	H	H
1-78	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-PrS-cHx)$	H	H
1-79	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-PrS-cHx)$	H	H
1-80	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-iPrS-cHx)$	H	H
1-81	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPrS-cHx)$	H	H
1-82	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-[3-(2-Et-PrS)-cHx]$	H	H
1-83	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-[4-(2-Et-PrS)-cHx]$	H	H
1-84	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-iBuS-cHx)$	H	H
1-85	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iBuS-cHx)$	H	H
1-86	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-cHx-cHx)$	H	H
1-87	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-cHx-cHx)$	H	H
1-88	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Ph-cHx)$	H	H
1-89	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Ph-cHx)$	H	H
1-90	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(2,4-diMe-cHx)$	H	H
1-91	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMe-cHx)$	H	H
1-92	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMe-cHx)$	H	H
1-93	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H
1-94	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	Me	H
1-95	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	Me
1-96	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	F	H
1-97	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	F
1-98	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-F-Ph)$	H	H
1-99	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-F-Ph)$	H	H

## 100

1-100	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-101	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-102	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-103	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-104	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Et-Ph})$	H	H
1-105	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-106	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-107	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-108	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-109	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-110	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-111	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-112	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-113	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-114	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-115	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-116	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-117	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-118	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-119	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-120	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-121	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-122	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-123	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-124	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-125	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-126	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-127	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-128	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H

1-129	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-130	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-131	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-132	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-133	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-134	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-135	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-136	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-137	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-138	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-139	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-140	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-141	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-142	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-143	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-144	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-145	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Np(1)}$	H	H
1-146	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Np(2)}$	H	H
1-147	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cPn}$	H	H
1-148	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
1-149	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	Me	H
1-150	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	Me
1-151	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	F	H
1-152	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	F
1-153	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-F-cHx})$	H	H
1-154	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-155	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
1-156	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
1-157	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Me-cHx})$	H	H

1-158	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-159	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Et-cHx})$	H	H
1-160	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-161	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-162	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-163	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-164	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-165	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-166	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-167	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-168	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-169	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-170	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-171	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-172	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-173	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-174	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-175	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-176	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-177	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-178	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-179	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-180	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-181	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-182	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-183	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-184	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-185	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-186	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H

1-187	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-188	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-189	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-190	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-191	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-192	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-193	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-194	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-195	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-196	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-197	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-198	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-199	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
1-200	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	Me	H
1-201	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	Me
1-202	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	F	H
1-203	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	F
1-204	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-205	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-206	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-207	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-208	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-209	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-210	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Et-Ph})$	H	H
1-211	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-212	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-213	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-214	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-215	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H

1-216	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-217	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-218	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-219	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-220	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-221	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-222	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-223	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-224	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-225	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-226	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-227	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-228	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-229	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-230	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-231	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-232	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-233	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-234	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-235	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-236	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-237	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-238	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-239	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-240	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-241	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-242	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-243	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-244	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H



1-245	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-246	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-247	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-248	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-249	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-250	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-251	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Np(1)}$	H	H
1-252	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Np(2)}$	H	H
1-253	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-cHx}$	H	H
1-254	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-255	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-256	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-257	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-258	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-259	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-260	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-261	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-262	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-263	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-Ph}$	H	H
1-264	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-265	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-266	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-267	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-268	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-269	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-270	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-271	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-272	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-273	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-cHx}$	H	H

1-274	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-F-cHx)}$	H	H
1-275	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Me-cHx)}$	H	H
1-276	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Et-cHx)}$	H	H
1-277	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H
1-278	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-MeO-cHx)}$	H	H
1-279	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-EtO-cHx)}$	H	H
1-280	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-MeS-cHx)}$	H	H
1-281	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-cHx-cHx)}$	H	H
1-282	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Ph-cHx)}$	H	H
1-283	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-Ph}$	H	H
1-284	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-F-Ph)}$	H	H
1-285	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Me-Ph)}$	H	H
1-286	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Et-Ph)}$	H	H
1-287	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-288	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-MeO-Ph)}$	H	H
1-289	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-EtO-Ph)}$	H	H
1-290	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-MeS-Ph)}$	H	H
1-291	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-cHx-Ph)}$	H	H
1-292	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Ph-Ph)}$	H	H
1-293	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cPn}$	H	H
1-294	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cHx}$	H	H
1-295	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cHx}$	Me	H
1-296	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cHx}$	H	Me
1-297	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cHx}$	F	H
1-298	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-cHx}$	H	F
1-299	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-F-cHx)}$	H	H
1-300	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-F-cHx)}$	H	H
1-301	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Cl-cHx)}$	H	H
1-302	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Br-cHx)}$	H	H

1-303	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Me-cHx})$	H	H
1-304	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-305	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Et-cHx})$	H	H
1-306	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-307	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-308	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-309	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-310	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-311	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-312	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-313	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-314	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-315	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-316	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-317	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-318	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-319	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-320	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-321	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-322	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[3\text{-(2-Et-PrO)-cHx}]$	H	H
1-323	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[4\text{-(2-Et-PrO)-cHx}]$	H	H
1-324	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-325	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-326	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-327	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-328	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-329	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-330	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-331	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrS-cHx})$	H	H

1-332	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-iPrS-cHx)}$	H	H
1-333	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-iPrS-cHx)}$	H	H
1-334	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-[3-(2-Et-PrS)-cHx]}$	H	H
1-335	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-[4-(2-Et-PrS)-cHx]}$	H	H
1-336	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-iBuS-cHx)}$	H	H
1-337	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-iBuS-cHx)}$	H	H
1-338	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-cHx-cHx)}$	H	H
1-339	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-cHx-cHx)}$	H	H
1-340	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Ph-cHx)}$	H	H
1-341	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Ph-cHx)}$	H	H
1-342	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(2,4-diMe-cHx)}$	H	H
1-343	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,4-diMe-cHx)}$	H	H
1-344	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,5-diMe-cHx)}$	H	H
1-345	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-Ph}$	H	H
1-346	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-Ph}$	Me	H
1-347	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-Ph}$	H	Me
1-348	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-Ph}$	F	H
1-349	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-Ph}$	H	F
1-350	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-F-Ph)}$	H	H
1-351	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-F-Ph)}$	H	H
1-352	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Cl-Ph)}$	H	H
1-353	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Br-Ph)}$	H	H
1-354	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Me-Ph)}$	H	H
1-355	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Me-Ph)}$	H	H
1-356	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Et-Ph)}$	H	H
1-357	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Et-Ph)}$	H	H
1-358	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Pr-Ph)}$	H	H
1-359	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Pr-Ph)}$	H	H
1-360	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-iPr-Ph)}$	H	H

1-361	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-362	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-363	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-364	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-365	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-366	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-367	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-368	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-369	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-370	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-371	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-372	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-373	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-374	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[3\text{-(2-Et-PrO)-Ph}]$	H	H
1-375	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[4\text{-(2-Et-PrO)-Ph}]$	H	H
1-376	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-377	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-378	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-379	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-380	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-381	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-382	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-383	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-384	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-385	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-386	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[3\text{-(2-Et-PrS)-Ph}]$	H	H
1-387	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[4\text{-(2-Et-PrS)-Ph}]$	H	H
1-388	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-389	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H

1-390	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-391	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-392	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-393	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-394	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-395	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-396	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-397	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-O-cHx}$	H	H
1-398	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-O-Ph}$	H	H
1-399	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-O-cHx}$	H	H
1-400	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-O-Ph}$	H	H
1-401	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-cHx}$	H	H
1-402	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-F-cHx)}$	H	H
1-403	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H
1-404	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Et-cHx)}$	H	H
1-405	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H
1-406	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeO-cHx)}$	H	H
1-407	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-EtO-cHx)}$	H	H
1-408	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeS-cHx)}$	H	H
1-409	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-cHx-cHx)}$	H	H
1-410	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Ph-cHx)}$	H	H
1-411	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-412	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-F-Ph)}$	H	H
1-413	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Me-Ph)}$	H	H
1-414	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Et-Ph)}$	H	H
1-415	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-416	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeO-Ph)}$	H	H
1-417	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-EtO-Ph)}$	H	H
1-418	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeS-Ph)}$	H	H

1-419	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-420	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H
1-421	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cPn}$	H	H
1-422	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H
1-423	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	Me	H
1-424	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	Me
1-425	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	F	H
1-426	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	F
1-427	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-428	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-429	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-430	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-431	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-432	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-433	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-434	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-435	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-436	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-437	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
1-438	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-439	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-440	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-441	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-442	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-443	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-444	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-445	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-446	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-447	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H

1-448	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-449	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-450	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H
1-451	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H
1-452	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H
1-453	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H
1-454	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H
1-455	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H
1-456	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{EtS}-\text{cHx})$	H	H
1-457	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{EtS}-\text{cHx})$	H	H
1-458	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{PrS}-\text{cHx})$	H	H
1-459	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{PrS}-\text{cHx})$	H	H
1-460	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrS}-\text{cHx})$	H	H
1-461	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrS}-\text{cHx})$	H	H
1-462	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{cHx}]$	H	H
1-463	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{cHx}]$	H	H
1-464	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuS}-\text{cHx})$	H	H
1-465	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuS}-\text{cHx})$	H	H
1-466	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H
1-467	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H
1-468	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H
1-469	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H
1-470	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(2,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-471	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-472	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-473	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H
1-474	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	Me	H
1-475	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	Me
1-476	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	F	H



1-477	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	F
1-478	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{Ph})$	H	H
1-479	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H
1-480	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{Ph})$	H	H
1-481	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{Ph})$	H	H
1-482	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H
1-483	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H
1-484	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H
1-485	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H
1-486	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Pr}-\text{Ph})$	H	H
1-487	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Pr}-\text{Ph})$	H	H
1-488	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iPr}-\text{Ph})$	H	H
1-489	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPr}-\text{Ph})$	H	H
1-490	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Bu}-\text{Ph})$	H	H
1-491	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Bu}-\text{Ph})$	H	H
1-492	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-493	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-494	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H
1-495	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H
1-496	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H
1-497	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H
1-498	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H
1-499	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H
1-500	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H
1-501	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H
1-502	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H
1-503	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H
1-504	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H
1-505	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H

1-506	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H
1-507	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H
1-508	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H
1-509	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H
1-510	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H
1-511	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H
1-512	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H
1-513	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H
1-514	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H
1-515	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H
1-516	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H
1-517	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H
1-518	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-519	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-520	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H
1-521	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H
1-522	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(2,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H
1-523	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H
1-524	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,5-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H
1-525	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H
1-526	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H
1-527	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H
1-528	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H
1-529	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{cHx}$	H	H
1-530	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-531	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-532	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-533	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-534	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H

1-535	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-cHx)	H	H
1-536	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeS-cHx)	H	H
1-537	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-cHx)	H	H
1-538	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-cHx)	H	H
1-539	H	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-540	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-Ph)	H	H
1-541	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-Ph)	H	H
1-542	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Pr-Ph)	H	H
1-543	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Bu-Ph)	H	H
1-544	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-Ph)	H	H
1-545	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-Ph)	H	H
1-546	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-PrO-Ph)	H	H
1-547	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-Ph)	H	H
1-548	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-Ph)	H	H
1-549	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-550	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-551	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-552	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-553	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-554	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-555	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-556	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-557	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-558	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-559	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-560	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-561	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-562	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-563	H	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H

1-564	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-MeO-Ph)$	H	H
1-565	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-EtO-Ph)$	H	H
1-566	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-MeS-Ph)$	H	H
1-567	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-cHx-Ph)$	H	H
1-568	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-Ph-Ph)$	H	H
1-569	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cPn$	H	H
1-570	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H
1-571	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	Me	H
1-572	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	Me
1-573	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	F	H
1-574	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	F
1-575	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-F-cHx)$	H	H
1-576	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-F-cHx)$	H	H
1-577	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Cl-cHx)$	H	H
1-578	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Br-cHx)$	H	H
1-579	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-Me-cHx)$	H	H
1-580	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Me-cHx)$	H	H
1-581	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-Et-cHx)$	H	H
1-582	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Et-cHx)$	H	H
1-583	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-Pr-cHx)$	H	H
1-584	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Pr-cHx)$	H	H
1-585	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-iPr-cHx)$	H	H
1-586	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-Bu-cHx)$	H	H
1-587	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Bu-cHx)$	H	H
1-588	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-CF_3-cHx)$	H	H
1-589	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-CF_3-cHx)$	H	H
1-590	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-MeO-cHx)$	H	H
1-591	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-MeO-cHx)$	H	H
1-592	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-EtO-cHx)$	H	H

1-593	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-594	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-595	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-596	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-597	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-598	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-599	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-600	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-601	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-602	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-603	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-604	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-605	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-606	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-607	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-608	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-609	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-610	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-611	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-612	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-613	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-614	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-615	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-616	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-617	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-618	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-619	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-620	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-621	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H

1-622	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	Me	H
1-623	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	Me
1-624	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	F	H
1-625	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	F
1-626	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-F-Ph)}$	H	H
1-627	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-F-Ph)}$	H	H
1-628	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Cl-Ph)}$	H	H
1-629	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Br-Ph)}$	H	H
1-630	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-Me-Ph)}$	H	H
1-631	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Me-Ph)}$	H	H
1-632	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-Et-Ph)}$	H	H
1-633	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Et-Ph)}$	H	H
1-634	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-Pr-Ph)}$	H	H
1-635	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Pr-Ph)}$	H	H
1-636	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-iPr-Ph)}$	H	H
1-637	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-iPr-Ph)}$	H	H
1-638	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-Bu-Ph)}$	H	H
1-639	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Bu-Ph)}$	H	H
1-640	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-641	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-642	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-MeO-Ph)}$	H	H
1-643	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-MeO-Ph)}$	H	H
1-644	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-EtO-Ph)}$	H	H
1-645	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-EtO-Ph)}$	H	H
1-646	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-PrO-Ph)}$	H	H
1-647	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-PrO-Ph)}$	H	H
1-648	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-iPrO-Ph)}$	H	H
1-649	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-iPrO-Ph)}$	H	H
1-650	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-[3-(2-Et-PrO)-Ph]}$	H	H

1-651	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-652	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-653	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-654	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-655	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-656	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-657	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-658	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-659	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-660	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-661	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-662	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-663	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-664	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-665	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-666	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-667	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-668	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-669	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-670	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-671	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-672	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-673	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Np(1)}$	H	H
1-674	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Np(2)}$	H	H
1-675	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cPn}$	H	H
1-676	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
1-677	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	Me	H
1-678	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	Me
1-679	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	F	H

1-680	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	F
1-681	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-682	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-683	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-684	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-685	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-686	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-687	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-688	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-689	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-690	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-691	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
1-692	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-693	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-694	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-695	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-696	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-697	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-698	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-699	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-700	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-701	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-702	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-703	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-704	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H
1-705	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H
1-706	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H
1-707	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H
1-708	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H



1-709	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-710	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-711	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-712	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-713	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-714	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-715	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-716	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-717	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H
1-718	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-719	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-720	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-721	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-722	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-723	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-724	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-725	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-726	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-727	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
1-728	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	Me	H
1-729	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	Me
1-730	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	F	H
1-731	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	F
1-732	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-733	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-734	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-735	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-736	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-737	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H

1-738	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Et-Ph})$	H	H
1-739	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-740	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-741	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-742	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-743	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-744	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-745	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-746	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-747	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-748	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-749	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-750	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-751	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-752	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-753	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-754	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-755	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-756	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-757	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H
1-758	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-759	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-760	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-761	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-762	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-763	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-764	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-765	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-766	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H

1-767	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-768	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-769	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H
1-770	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-771	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-772	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-773	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-774	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-775	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-776	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-777	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-778	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-779	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Np (1)}$	H	H
1-780	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Np (2)}$	H	H
1-781	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
1-782	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-783	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-784	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-785	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-786	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-787	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-788	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-789	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-790	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-791	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
1-792	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-793	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-794	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-795	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H

1-796	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-797	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-798	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-799	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-800	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-801	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
1-802	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-803	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-804	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-805	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-806	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-807	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-808	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-809	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-810	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-811	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
1-812	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-813	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-814	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-815	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-816	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-817	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-818	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-819	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-820	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-821	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-O-cHx}$	H	H
1-822	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-O-(4-F-cHx)}$	H	H
1-823	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-O-(4-Me-cHx)}$	H	H
1-824	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-O-(4-Et-cHx)}$	H	H

1-825	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-826	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-827	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-828	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H
1-829	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H
1-830	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H
1-831	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Ph}$	H	H
1-832	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H
1-833	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H
1-834	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H
1-835	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-836	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H
1-837	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H
1-838	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H
1-839	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-840	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H
1-841	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cPn}$	H	H
1-842	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H
1-843	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	Me	H
1-844	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	Me
1-845	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	F	H
1-846	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	F
1-847	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-848	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-849	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-850	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-851	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-852	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-853	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H

1-854	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-855	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-856	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-857	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-858	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-859	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-860	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-861	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-862	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-863	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-864	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-865	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-866	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-867	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-868	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-869	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-870	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-871	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H
1-872	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-873	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-874	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-875	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-876	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-877	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-878	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-879	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-880	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-881	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-882	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H

1-883	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2\text{-Et-PrS})-\text{cHx}]$	H	H
1-884	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-885	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-886	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-887	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-888	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-889	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-890	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-891	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-892	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-893	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H
1-894	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	Me	H
1-895	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	Me
1-896	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	F	H
1-897	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	F
1-898	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-899	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-900	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-901	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-902	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-903	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-904	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Et-Ph})$	H	H
1-905	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-906	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-907	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-908	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-909	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-910	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-911	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H

1-912	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-913	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H
1-914	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H
1-915	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H
1-916	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H
1-917	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H
1-918	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H
1-919	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H
1-920	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H
1-921	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H
1-922	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H
1-923	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H
1-924	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H
1-925	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H
1-926	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H
1-927	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H
1-928	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H
1-929	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H
1-930	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H
1-931	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H
1-932	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H
1-933	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H
1-934	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H
1-935	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H
1-936	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H
1-937	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H
1-938	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-939	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H
1-940	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H



1-941	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-942	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-943	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-944	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-945	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{O-CHx}$	H	H
1-946	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{O-Ph}$	H	H
1-947	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{O-CHx}$	H	H
1-948	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{O-Ph}$	H	H
1-949	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-CHx}$	H	H
1-950	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-F-CHx)}$	H	H
1-951	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Me-CHx)}$	H	H
1-952	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Et-CHx)}$	H	H
1-953	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-CHx)}$	H	H
1-954	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-MeO-CHx)}$	H	H
1-955	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-EtO-CHx)}$	H	H
1-956	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-MeS-CHx)}$	H	H
1-957	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-CHx-CHx)}$	H	H
1-958	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Ph-CHx)}$	H	H
1-959	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-960	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-F-Ph)}$	H	H
1-961	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Me-Ph)}$	H	H
1-962	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Et-Ph)}$	H	H
1-963	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-964	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-MeO-Ph)}$	H	H
1-965	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-EtO-Ph)}$	H	H
1-966	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-MeS-Ph)}$	H	H
1-967	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-CHx-Ph)}$	H	H
1-968	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-OCH}_2\text{-(4-Ph-Ph)}$	H	H
1-969	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-OCH}_2\text{-cPn}$	H	H

1-970	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H
1-971	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	Me	H
1-972	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	Me
1-973	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	F	H
1-974	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	F
1-975	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-976	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-977	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-978	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-979	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-980	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-981	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-982	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-983	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-984	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-985	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
1-986	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-987	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-988	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-989	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-990	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-991	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-992	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-993	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-994	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-995	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-996	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-997	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-998	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})\text{cHx}]$	H	H

1-999	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{cHx}]$	H	H
1-1000	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-1001	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H
1-1002	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1003	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1004	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-1005	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H
1-1006	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-1007	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H
1-1008	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-1009	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H
1-1010	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{cHx}]$	H	H
1-1011	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{cHx}]$	H	H
1-1012	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-1013	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H
1-1014	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-1015	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H
1-1016	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-1017	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H
1-1018	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1019	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1020	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1021	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-1022	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	Me	H
1-1023	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	Me
1-1024	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	F	H
1-1025	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	F
1-1026	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-1027	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-F-Ph})$	H	H

1-1028	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1029	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-1030	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1031	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1032	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1033	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1034	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1035	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1036	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1037	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1038	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1039	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1040	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1041	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1042	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1043	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1044	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1045	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1046	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1047	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1048	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1049	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1050	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{Ph}]$	H	H
1-1051	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{Ph}]$	H	H
1-1052	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-1053	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H
1-1054	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1055	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1056	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H

1-1057	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H
1-1058	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-1059	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H
1-1060	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-1061	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H
1-1062	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{Ph}]$	H	H
1-1063	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{Ph}]$	H	H
1-1064	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-1065	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H
1-1066	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-1067	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-1068	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-1069	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-1070	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1071	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1072	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1073	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H
1-1074	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-1075	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H
1-1076	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-1077	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-\text{CH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H
1-1078	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-\text{CH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H
1-1079	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H
1-1080	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H
1-1081	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
1-1082	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
1-1083	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
1-1084	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-1085	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-cHx})$	H	H

1-1086	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1087	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1088	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1089	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1090	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1091	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1092	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1093	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1094	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1095	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1096	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1097	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1098	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1099	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1100	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1101	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1102	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1103	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1104	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1105	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1106	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1107	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1108	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1109	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1110	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1111	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1112	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1113	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1114	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H

1-1115	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1116	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1117	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1118	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1119	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1120	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1121	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1122	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1123	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1124	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1125	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-1126	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-1127	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H
1-1128	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H
1-1129	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1130	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1131	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1132	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1133	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1134	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1135	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1136	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1137	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H
1-1138	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H
1-1139	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1140	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1141	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1142	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1143	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H

1-1144	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1145	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1146	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1147	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cPn	H	H
1-1148	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H
1-1149	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	Me	H
1-1150	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	Me
1-1151	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	F	H
1-1152	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	F
1-1153	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-cHx)	H	H
1-1154	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H
1-1155	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1156	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Br-cHx)	H	H
1-1157	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-cHx)	H	H
1-1158	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1159	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Et-cHx)	H	H
1-1160	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1161	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Pr-cHx)	H	H
1-1162	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1163	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1164	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Bu-cHx)	H	H
1-1165	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1166	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1167	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1168	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-cHx)	H	H
1-1169	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1170	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtO-cHx)	H	H
1-1171	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1172	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrO-cHx)	H	H



1-1173	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1174	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1175	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1176	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1177	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1178	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1179	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1180	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1181	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1182	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-cHx)	H	H
1-1183	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-cHx)	H	H
1-1184	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-cHx)	H	H
1-1185	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-cHx)	H	H
1-1186	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1187	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1188	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1189	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1190	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1191	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1192	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-cHx)	H	H
1-1193	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1194	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-cHx)	H	H
1-1195	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1196	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1197	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1198	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1199	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H
1-1200	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	Me	H
1-1201	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	Me

1-1202	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	F	H
1-1203	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	F
1-1204	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H
1-1205	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H
1-1206	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1207	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Br-Ph)	H	H
1-1208	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H
1-1209	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1210	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Et-Ph)	H	H
1-1211	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1212	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1213	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1214	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1215	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1216	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1217	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1218	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1219	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1220	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1221	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1222	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1223	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1224	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1225	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1226	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1227	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1228	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1229	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1230	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuO-Ph)	H	H

1-1231	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1232	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1233	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1234	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-Ph)	H	H
1-1235	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-Ph)	H	H
1-1236	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-Ph)	H	H
1-1237	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-Ph)	H	H
1-1238	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-1239	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1240	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-1241	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-1242	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-1243	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-1244	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-Ph)	H	H
1-1245	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1246	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-Ph)	H	H
1-1247	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1248	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1249	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1250	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1251	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-cHx	H	H
1-1252	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H
1-1253	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-cHx	H	H
1-1254	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-Ph	H	H
1-1255	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1256	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1257	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1258	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1259	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H

1-1260	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1261	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1262	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1263	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1264	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1265	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1266	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1267	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1268	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1269	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1270	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1271	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1272	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1273	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1274	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1275	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -cPn	H	H
1-1276	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1277	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	Me	H
1-1278	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	Me
1-1279	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	F	H
1-1280	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	F
1-1281	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-cHx)	H	H
1-1282	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1283	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H
1-1284	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-cHx)	H	H
1-1285	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-cHx)	H	H
1-1286	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1287	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-cHx)	H	H
1-1288	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H

1-1289	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H
1-1290	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H
1-1291	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H
1-1292	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H
1-1293	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H
1-1294	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1295	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1296	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H
1-1297	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1298	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H
1-1299	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1300	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H
1-1301	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H
1-1302	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1303	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1304	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1305	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1306	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1307	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1308	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H
1-1309	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1310	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H
1-1311	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H
1-1312	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H
1-1313	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H
1-1314	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1315	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1316	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1317	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H

1-1318	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1319	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1320	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H
1-1321	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1322	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H
1-1323	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1324	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1325	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1326	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1327	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1328	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	Me	H
1-1329	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	Me
1-1330	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	F	H
1-1331	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	F
1-1332	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1333	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1334	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1335	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-Ph)	H	H
1-1336	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1337	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1338	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-1339	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1340	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H
1-1341	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H
1-1342	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H
1-1343	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H
1-1344	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H
1-1345	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H
1-1346	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H

1-1347	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1348	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1349	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1350	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H
1-1351	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1352	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H
1-1353	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H
1-1354	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1355	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1356	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1357	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1358	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H
1-1359	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1360	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H
1-1361	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1362	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H
1-1363	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H
1-1364	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H
1-1365	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H
1-1366	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H
1-1367	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1368	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1369	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1370	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H
1-1371	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H
1-1372	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H
1-1373	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1374	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H
1-1375	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H

1-1376	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2, 4-diMe-Ph)	H	H
1-1377	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3, 4-diMe-Ph)	H	H
1-1378	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3, 5-diMe-Ph)	H	H
1-1379	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1380	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1381	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1382	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1383	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1384	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1385	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1386	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H
1-1387	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1388	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1389	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1390	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1391	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1392	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1393	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1394	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1395	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1396	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1397	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1398	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1399	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1400	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1401	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1402	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1403	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1404	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H



1-1405	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1406	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1407	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1408	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1409	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1410	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H
1-1411	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H
1-1412	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H
1-1413	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H
1-1414	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H
1-1415	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H
1-1416	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H
1-1417	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H
1-1418	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H
1-1419	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1420	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1421	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1422	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1423	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1424	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1425	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H
1-1426	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1427	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H
1-1428	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H
1-1429	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1430	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1431	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H
1-1432	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H
1-1433	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H

1-1434	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-F-Ph	H	H
1-1435	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-F-Ph	H	H
1-1436	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diF-Ph	H	H
1-1437	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Cl-Ph	H	H
1-1438	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Cl-Ph	H	H
1-1439	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diCl-Ph	H	H
1-1440	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Me-Ph	H	H
1-1441	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Me-Ph	H	H
1-1442	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diMe-Ph	H	H
1-1443	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H
1-1444	H	H	H	Me	2	-3-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H
1-1445	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-1446	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H
1-1447	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H
1-1448	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H
1-1449	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H
1-1450	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H
1-1451	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
1-1452	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
1-1453	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
1-1454	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
1-1455	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H
1-1456	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H
1-1457	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1458	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1459	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1460	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1461	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPn	H	H
1-1462	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H

1-1463	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	Me	H
1-1464	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	Me
1-1465	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	F	H
1-1466	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	F
1-1467	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-F-cHx)}$	H	H
1-1468	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Cl-cHx)}$	H	H
1-1469	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Br-cHx)}$	H	H
1-1470	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H
1-1471	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Et-cHx)}$	H	H
1-1472	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Pr-cHx)}$	H	H
1-1473	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-iPr-cHx)}$	H	H
1-1474	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H
1-1475	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-MeO-cHx)}$	H	H
1-1476	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-EtO-cHx)}$	H	H
1-1477	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-PrO-cHx)}$	H	H
1-1478	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-iPrO-cHx)}$	H	H
1-1479	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(3-MeS-cHx)}$	H	H
1-1480	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-MeS-cHx)}$	H	H
1-1481	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(2, 4-diMe-cHx)}$	H	H
1-1482	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(3, 4-diMe-cHx)}$	H	H
1-1483	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(3, 5-diMe-cHx)}$	H	H
1-1484	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
1-1485	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	Me	H
1-1486	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	Me
1-1487	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	F	H
1-1488	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	F
1-1489	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-F-Ph)}$	H	H
1-1490	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Cl-Ph)}$	H	H
1-1491	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-(4-Br-Ph)}$	H	H

1-1492	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1493	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1494	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1495	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1496	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1497	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1498	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1499	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1500	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1501	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1502	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1503	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1504	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1505	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1506	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3, 5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1507	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cPn}$	H	H
1-1508	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
1-1509	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	Me	H
1-1510	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	Me
1-1511	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	F	H
1-1512	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	F
1-1513	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-1514	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
1-1515	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
1-1516	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-1517	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-1518	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-1519	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-1520	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H

1-1521	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-1522	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-1523	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-1524	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-1525	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-1526	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1527	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1528	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1529	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1530	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1531	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
1-1532	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	Me	H
1-1533	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	Me
1-1534	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	F	H
1-1535	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	F
1-1536	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-1537	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1538	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-1539	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1540	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1541	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1542	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1543	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1544	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1545	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1546	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1547	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1548	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1549	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H

1-1550	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1551	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1552	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1553	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1554	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-cHx}$	H	H
1-1555	H	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-Ph}$	H	H
1-1556	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H
1-1557	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-Ph}$	H	H
1-1558	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H
1-1559	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H
1-1560	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cPn}$	H	H
1-1561	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
1-1562	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	Me	H
1-1563	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	Me
1-1564	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	F	H
1-1565	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	F
1-1566	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-cHx})$	H	H
1-1567	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
1-1568	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
1-1569	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-1570	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-1571	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-1572	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-1573	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-1574	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-1575	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-1576	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-1577	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-1578	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H

1-1579	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1580	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1581	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1582	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1583	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1584	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
1-1585	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	Me	H
1-1586	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	Me
1-1587	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	F	H
1-1588	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	F
1-1589	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-1590	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1591	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-1592	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1593	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1594	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1595	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1596	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1597	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1598	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1599	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1600	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1601	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1602	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1603	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1604	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1605	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1606	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1607	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cPn}$	H	H

1-1608	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H
1-1609	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	Me	H
1-1610	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	Me
1-1611	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	F	H
1-1612	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	F
1-1613	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
1-1614	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
1-1615	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
1-1616	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
1-1617	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
1-1618	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
1-1619	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
1-1620	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
1-1621	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
1-1622	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
1-1623	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
1-1624	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
1-1625	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
1-1626	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H
1-1627	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-1628	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-1629	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
1-1630	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H
1-1631	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	Me	H
1-1632	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	Me
1-1633	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	F	H
1-1634	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	F
1-1635	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H
1-1636	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})$	H	H



1-1637	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-1638	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1639	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1640	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1641	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
1-1642	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1643	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1644	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1645	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1646	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1647	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1648	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1649	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1650	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1651	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1652	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1653	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
1-1654	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
1-1655	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
1-1656	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
1-1657	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O-cHx}$	H	H
1-1658	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O-Ph}$	H	H
1-1659	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cPn}$	H	H
1-1660	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	H
1-1661	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	Me	H
1-1662	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	Me
1-1663	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	F	H
1-1664	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	F
1-1665	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-(4-F-cHx)}$	H	H

1-1666	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
1-1667	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
1-1668	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
1-1669	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
1-1670	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
1-1671	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
1-1672	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
1-1673	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
1-1674	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
1-1675	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
1-1676	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
1-1677	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
1-1678	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1679	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
1-1680	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1681	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1682	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
1-1683	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H
1-1684	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	Me	H
1-1685	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	Me
1-1686	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	F	H
1-1687	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	F
1-1688	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-1689	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1690	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
1-1691	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1692	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
1-1693	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
1-1694	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H

1-1695	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
1-1696	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1697	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1698	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
1-1699	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
1-1700	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
1-1701	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
1-1702	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1703	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1704	H	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1705	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
1-1706	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
1-1707	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
1-1708	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
1-1709	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
1-1710	H	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
1-1711	H	H	H	Et	2	$-\text{CH(OH)}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
1-1712	H	H	H	Et	2	$-\text{CH(OH)}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
1-1713	H	H	H	Et	2	$-\text{CH(OH)}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
1-1714	H	H	H	Et	2	$-\text{CH(OH)}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
1-1715	H	H	H	Et	2	$-4-(\text{cHx-CH}_2\text{O})\text{Ph}$	H	H
1-1716	H	H	H	Et	2	$-4-[\text{cHx}-(\text{CH}_2)_2\text{O}]\text{Ph}$	H	H
1-1717	H	H	H	Et	2	$-4-[\text{cHx}-(\text{CH}_2)_3\text{O}]\text{Ph}$	H	H
1-1718	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-Ph})$	H	H
1-1719	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-2-F-Ph})$	H	H
1-1720	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-3-F-Ph})$	H	H
1-1721	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-2,3-diF-Ph})$	H	H
1-1722	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-2-Cl-Ph})$	H	H
1-1723	H	H	H	Et	2	$-(4\text{-BzO-3-Cl-Ph})$	H	H

1-1724	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
1-1725	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
1-1726	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
1-1727	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
1-1728	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H
1-1729	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H
1-1730	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
1-1731	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H
1-1732	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
1-1733	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H
1-1734	H	H	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H
1-1735	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
1-1736	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
1-1737	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
1-1738	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
1-1739	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
1-1740	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
1-1741	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
1-1742	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-1743	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1744	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1745	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1746	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-1747	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1748	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1749	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1750	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1751	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1752	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H

1-1753	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1754	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1755	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1756	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1757	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1758	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1759	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1760	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1761	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1762	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1763	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1764	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1765	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1766	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1767	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1768	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1769	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1770	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1771	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1772	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1773	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1774	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-1775	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1776	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1777	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1778	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1779	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1780	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1781	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H

1-1782	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3,5-diCF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-1783	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3-MeO-Ph)}$	H	H
1-1784	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3,4-diMeO-Ph)}$	H	H
1-1785	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3,5-diMeO-Ph)}$	H	H
1-1786	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3,4,5-triMeO-Ph)}$	H	H
1-1787	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(3-Ac-Ph)}$	H	H
1-1788	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-(4-Ac-Ph)}$	H	H
1-1789	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,4-diF-Ph)}$	H	H
1-1790	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,5-diF-Ph)}$	H	H
1-1791	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,4-diMeO-Ph)}$	H	H
1-1792	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,5-diMeO-Ph)}$	H	H
1-1793	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,4,5-triMeO-Ph)}$	H	H
1-1794	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Ac-Ph)}$	H	H
1-1795	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Ac-Ph)}$	H	H
1-1796	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3-F-Ph)}$	H	H
1-1797	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,4-diF-Ph)}$	H	H
1-1798	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,5-diF-Ph)}$	H	H
1-1799	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3-Cl-Ph)}$	H	H
1-1800	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(4-Cl-Ph)}$	H	H
1-1801	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,4-diCl-Ph)}$	H	H
1-1802	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,5-diCl-Ph)}$	H	H
1-1803	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3-Me-Ph)}$	H	H
1-1804	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,4-diMe-Ph)}$	H	H
1-1805	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,5-diMe-Ph)}$	H	H
1-1806	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3-CF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-1807	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,4-diCF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-1808	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,5-diCF}_3\text{-Ph)}$	H	H
1-1809	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3-MeO-Ph)}$	H	H
1-1810	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-(3,4-diMeO-Ph)}$	H	H

1-1811	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1812	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1813	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1814	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1815	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1816	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1817	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1818	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1819	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1820	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1821	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1822	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1823	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1824	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1825	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1826	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1827	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-1828	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1829	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1830	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1831	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1832	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1833	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1834	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-Me-Ph})$	H	H
1-1835	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1836	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1837	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
1-1838	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1839	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H

1-1840	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1841	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H
1-1842	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1843	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1844	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1845	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1846	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1847	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4\text{-CO}_2\text{H-Ph})$	H	H
1-1848	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1849	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1850	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1851	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1852	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1853	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1854	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H
1-1855	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1856	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H
1-1857	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H
1-1858	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1859	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H
1-1860	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-F-Ph})$	H	H
1-1861	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-Ph})$	H	H
1-1862	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1863	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H
1-1864	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1865	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
1-1866	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1867	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H
1-1868	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Me-Ph})$	H	H



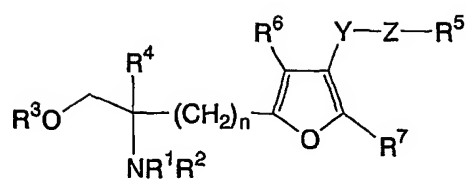
1-1869	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1870	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1871	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1872	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-1873	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1874	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1875	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1876	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1877	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1878	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1879	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1880	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1881	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1882	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1883	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1884	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-1885	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-1886	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1887	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1888	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1889	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-1890	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1891	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1892	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1893	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1894	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1895	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1896	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1897	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H

1-1898	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1899	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1900	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1901	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1902	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1903	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-1904	H	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-1905	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1906	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H
1-1907	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1908	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1909	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-1910	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1911	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1912	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1913	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1914	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H
1-1915	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1916	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1917	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H
1-1918	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H
1-1919	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1920	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1921	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1922	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1923	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1924	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H
1-1925	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1926	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H

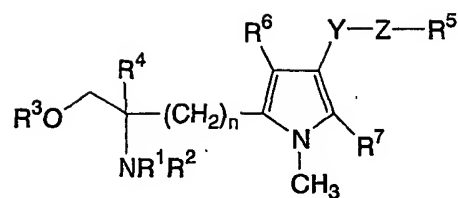
1-1927	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1928	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H
1-1929	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-1930	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H
1-1931	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H
1-1932	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1933	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1934	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H
1-1935	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H
1-1936	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1937	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1938	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H
1-1939	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1940	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1941	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1942	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1943	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H
1-1944	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H
1-1945	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1946	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1947	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1948	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H
1-1949	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H

---

表 2

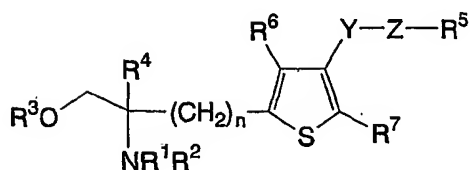


(Ib-1)



(Ib-2)

又は



(Ib-3)

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
2- 1	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2- 2	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H
2- 3	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2- 4	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H
2- 5	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPn	H	H
2- 6	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2- 7	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	Me	H
2- 8	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	Me
2- 9	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	F	H
2-10	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	F
2-11	H	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H

## 165

2-12	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
2-13	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
2-14	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
2-15	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
2-16	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
2-17	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
2-18	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
2-19	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
2-20	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
2-21	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
2-22	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
2-23	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-24	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-25	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-26	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-27	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-28	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
2-29	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	Me	H
2-30	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	Me
2-31	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	F	H
2-32	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	F
2-33	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-F-Ph})$	H	H
2-34	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
2-35	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
2-36	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
2-37	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
2-38	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
2-39	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
2-40	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H

2-41	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
2-42	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
2-43	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
2-44	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
2-45	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
2-46	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-47	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-48	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-49	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-50	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3, 5\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-51	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cPn}$	H	H
2-52	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
2-53	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	Me	H
2-54	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	Me
2-55	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	F	H
2-56	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	F
2-57	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H
2-58	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H
2-59	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-cHx})$	H	H
2-60	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H
2-61	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
2-62	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
2-63	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
2-64	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
2-65	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
2-66	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
2-67	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
2-68	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
2-69	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H

2-70	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-71	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-72	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-73	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-74	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-75	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
2-76	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	Me	H
2-77	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	Me
2-78	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	F	H
2-79	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	F
2-80	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H
2-81	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
2-82	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
2-83	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
2-84	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
2-85	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
2-86	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
2-87	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
2-88	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
2-89	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
2-90	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
2-91	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
2-92	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
2-93	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-94	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-95	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-96	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-97	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-98	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-cHx}$	H	H

2-99	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-Ph}$	H	H
2-100	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_8\text{-cHx}$	H	H
2-101	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_8\text{-Ph}$	H	H
2-102	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H
2-103	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-Ph}$	H	H
2-104	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H
2-105	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H
2-106	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cPn}$	H	H
2-107	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
2-108	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	Me	H
2-109	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	Me
2-110	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	F	H
2-111	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	F
2-112	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-F-cHx)}$	H	H
2-113	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Cl-cHx)}$	H	H
2-114	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Br-cHx)}$	H	H
2-115	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H
2-116	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Et-cHx)}$	H	H
2-117	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Pr-cHx)}$	H	H
2-118	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-iPr-cHx)}$	H	H
2-119	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-Bu-cHx)}$	H	H
2-120	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H
2-121	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-MeO-cHx)}$	H	H
2-122	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-EtO-cHx)}$	H	H
2-123	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-PrO-cHx)}$	H	H
2-124	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-iPrO-cHx)}$	H	H
2-125	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(3-MeS-cHx)}$	H	H
2-126	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(4-MeS-cHx)}$	H	H
2-127	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-(2,4-diMe-cHx)}$	H	H



2-128	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-129	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-130	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
2-131	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	Me	H
2-132	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	Me
2-133	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	F	H
2-134	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	F
2-135	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-Ph})$	H	H
2-136	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
2-137	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
2-138	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
2-139	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
2-140	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
2-141	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
2-142	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
2-143	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
2-144	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
2-145	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
2-146	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
2-147	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
2-148	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-149	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-150	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-151	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-152	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-153	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cPn}$	H	H
2-154	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
2-155	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	Me	H
2-156	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	Me

2-157	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	F	H
2-158	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	F
2-159	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H
2-160	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H
2-161	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H
2-162	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H
2-163	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H
2-164	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H
2-165	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H
2-166	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H
2-167	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H
2-168	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H
2-169	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H
2-170	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H
2-171	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H
2-172	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H
2-173	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
2-174	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
2-175	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H
2-176	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H
2-177	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	Me	H
2-178	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	Me
2-179	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	F	H
2-180	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	F
2-181	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H
2-182	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{Ph})$	H	H
2-183	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Br}-\text{Ph})$	H	H
2-184	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H
2-185	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H

2-186	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
2-187	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
2-188	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
2-189	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
2-190	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H
2-191	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
2-192	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
2-193	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
2-194	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-195	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-196	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-197	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-198	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-199	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
2-200	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
2-201	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H
2-202	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H
2-203	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O-cHx}$	H	H
2-204	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O-Ph}$	H	H
2-205	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cPn}$	H	H
2-206	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	H
2-207	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	Me	H
2-208	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	Me
2-209	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	F	H
2-210	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	F
2-211	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-(4-F-cHx)}$	H	H
2-212	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-(4-Cl-cHx)}$	H	H
2-213	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-(4-Br-cHx)}$	H	H
2-214	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-(4-Me-cHx)}$	H	H

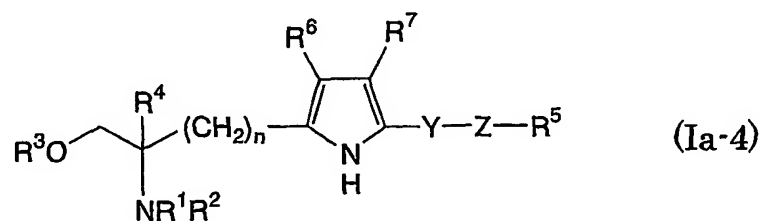
2-215	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-cHx})$	H	H
2-216	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H
2-217	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H
2-218	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H
2-219	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H
2-220	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H
2-221	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H
2-222	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H
2-223	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H
2-224	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-225	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H
2-226	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-227	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-228	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H
2-229	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H
2-230	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	Me	H
2-231	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	Me
2-232	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	F	H
2-233	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	F
2-234	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-F-Ph})$	H	H
2-235	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H
2-236	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Br-Ph})$	H	H
2-237	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Me-Ph})$	H	H
2-238	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-Ph})$	H	H
2-239	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H
2-240	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H
2-241	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H
2-242	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H
2-243	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H

2-244	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H
2-245	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H
2-246	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H
2-247	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H
2-248	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-249	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-250	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H
2-251	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
2-252	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
2-253	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
2-254	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
2-255	H	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
2-256	H	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
2-257	H	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
2-258	H	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
2-259	H	H	H	Me	2	$-4-(\text{cHx-CH}_2\text{O})\text{Ph}$	H	H
2-260	H	H	H	Me	2	$-4-[\text{cHx}-(\text{CH}_2)_2\text{O}]\text{Ph}$	H	H
2-261	H	H	H	Me	2	$-4-[\text{cHx}-(\text{CH}_2)_3\text{O}]\text{Ph}$	H	H
2-262	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-Ph})$	H	H
2-263	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2-F-Ph})$	H	H
2-264	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-3-F-Ph})$	H	H
2-265	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2,3-diF-Ph})$	H	H
2-266	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2-Cl-Ph})$	H	H
2-267	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-3-Cl-Ph})$	H	H
2-268	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2,3-diCl-Ph})$	H	H
2-269	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2-Me-Ph})$	H	H
2-270	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-3-Me-Ph})$	H	H
2-271	H	H	H	Me	2	$-(4\text{-BzO-2,3-diMe-Ph})$	H	H
2-272	H	H	H	Me	2	$-4-[\text{Ph}-(\text{CH}_2)_2\text{O}]\text{-Ph}$	H	H

174

2-273	H	H	H	Me	2	-3-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H
2-274	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-275	H	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-276	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-277	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-278	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-279	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-280	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-281	H	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H
2-282	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H
2-283	H	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H
2-284	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H
2-285	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H
2-286	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H
2-287	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-288	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H
2-289	H	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H

表 3

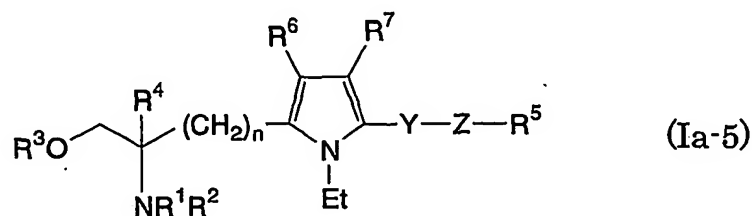


Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
--------	----------------	----------------	----------------	----------------	---	---------------------	----------------	----------------

175

3-1	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
3-2	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
3-3	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
3-4	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
3-5	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H
3-6	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H
3-7	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
3-8	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
3-9	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H
3-10	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H
3-11	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
3-12	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H

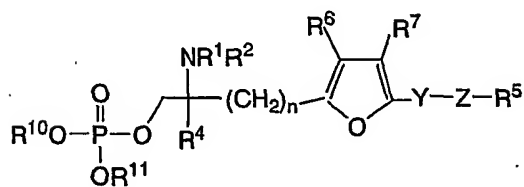
表 4



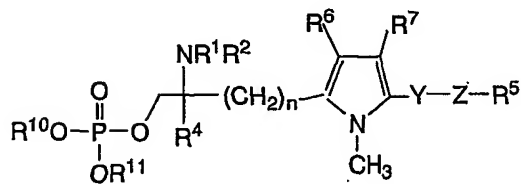
Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
4-1	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H
4-2	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H
4-3	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H
4-4	H	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H
4-5	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H

4-6	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H
4-7	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H
4-8	H	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H
4-9	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H
4-10	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H
4-11	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H
4-12	H	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H

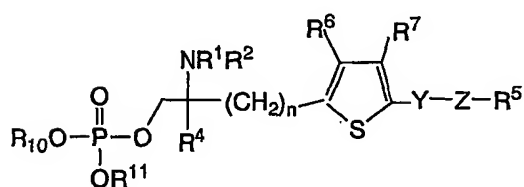
表 5



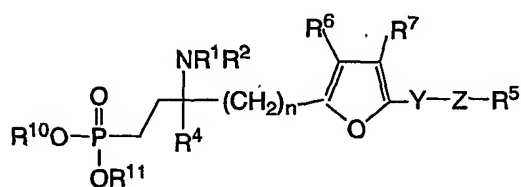
(IIa-1)



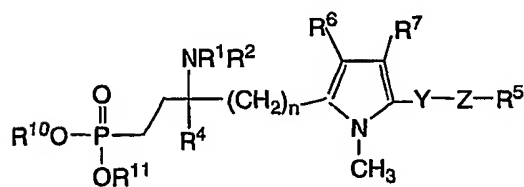
(IIa-2)



(IIa-3)

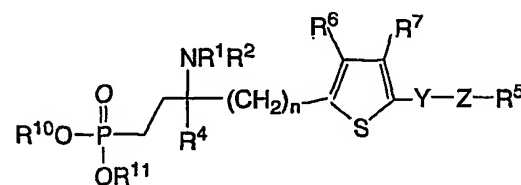


(IIIa-1)



(IIIa-2)

又は



(IIIa-3)

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
5-1	H	H	Me	1	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H



5-2	H	H	Me	1	$-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-3	H	H	Me	1	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-4	H	H	Me	1	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-5	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-6	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-7	H	H	Me	1	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-8	H	H	Me	1	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-9	H	H	Me	1	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-10	H	H	Me	1	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-11	H	H	Me	1	$-4-(\text{cHx}-\text{CH}_2\text{O})\text{Ph}$	H	H	H	H
5-12	H	H	Me	1	$-(4-\text{BzO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-13	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cPn}$	H	H	H	H
5-14	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cPn}$	H	H	H	H
5-15	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-16	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-17	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-18	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-19	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-20	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-21	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-22	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-23	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-24	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-25	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-26	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-27	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-28	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-29	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-30	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H

5-31	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-32	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-33	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-34	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-35	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-36	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-37	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-38	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-39	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-40	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-41	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-42	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-43	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-44	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-45	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-46	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-47	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-48	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-49	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-50	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-51	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-52	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-53	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-54	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-55	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-56	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-57	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-58	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-59	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H

5-60	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-61	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-62	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-63	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-64	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-65	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-66	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-67	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-68	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-69	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-70	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-71	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-72	H	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-73	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-74	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-75	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-76	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-77	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-78	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-79	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-80	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-81	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-82	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-83	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-84	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-85	H	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-86	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-87	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-88	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H

5-89	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-90	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-91	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
5-92	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
5-93	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
5-94	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
5-95	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-cHx-Ph)$	H	H	H	H
5-96	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-Ph-Ph)$	H	H	H	H
5-97	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cPn$	H	H	H	H
5-98	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-99	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	Me	H	H	H
5-100	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	Me	H	H
5-101	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	F	H	H	H
5-102	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	F	H	H
5-103	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-104	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-105	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-106	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-F-cHx)$	H	H	H	H
5-107	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
5-108	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Cl-cHx)$	H	H	H	H
5-109	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Br-cHx)$	H	H	H	H
5-110	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-111	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-112	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-113	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-114	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-115	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-116	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
5-117	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Bu-cHx)$	H	H	H	H

5-118	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-119	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-120	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-121	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-122	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-123	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-124	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-125	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-126	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-127	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-128	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-129	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-130	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-131	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-132	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-133	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-134	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-135	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-136	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-137	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-138	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-139	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-140	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-141	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-142	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-143	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-144	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-145	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-146	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H

5-147	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-148	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-149	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(2,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-150	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-151	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-152	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-153	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	Me	H	H	H
5-154	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	Me	H	H
5-155	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	F	H	H	H
5-156	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	F	H	H
5-157	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-158	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-159	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-160	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-F-Ph)$	H	H	H	H
5-161	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-162	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
5-163	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
5-164	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-165	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-166	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-167	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-168	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Pr-Ph)$	H	H	H	H
5-169	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Pr-Ph)$	H	H	H	H
5-170	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-iPr-Ph)$	H	H	H	H
5-171	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPr-Ph)$	H	H	H	H
5-172	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Bu-Ph)$	H	H	H	H
5-173	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Bu-Ph)$	H	H	H	H
5-174	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
5-175	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H

5-176	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-177	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-178	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-179	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-180	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-181	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-182	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-183	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-184	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-185	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-186	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-187	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iBuO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-188	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-189	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-190	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-191	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{EtS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-192	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-193	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{PrS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-194	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-195	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iPrS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-196	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[3-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-197	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-[4-(2-\text{Et}-\text{PrS})-\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-198	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-199	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iBuS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-200	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-201	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-202	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-203	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-204	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H

5-205	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
5-206	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMe-Ph)$	H	H	H	H
5-207	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Np(1)$	H	H	H	H
5-208	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Np(2)$	H	H	H	H
5-209	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cPn$	H	H	H	H
5-210	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-211	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	Me	H	H	H
5-212	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	Me	H	H
5-213	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	F	H	H	H
5-214	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	F	H	H
5-215	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-216	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-217	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-218	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-F-cHx)$	H	H	H	H
5-219	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
5-220	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Cl-cHx)$	H	H	H	H
5-221	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Br-cHx)$	H	H	H	H
5-222	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-223	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-224	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-225	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-226	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-227	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-228	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
5-229	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-Bu-cHx)$	H	H	H	H
5-230	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Bu-cHx)$	H	H	H	H
5-231	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-232	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-233	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-MeO-cHx)$	H	H	H	H



5-234	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-235	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-236	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-237	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-238	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-239	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-240	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-241	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-242	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-243	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-244	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-245	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-246	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-247	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-248	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-249	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-250	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-251	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-252	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-253	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-254	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-255	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-256	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-257	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-258	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-259	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-260	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-261	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-262	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H

5-263	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-264	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-265	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	Me	H	H	H
5-266	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	Me	H	H
5-267	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	F	H	H	H
5-268	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	F	H	H
5-269	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-270	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-271	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-272	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-273	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-274	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-275	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-276	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-277	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-278	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-279	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-280	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-281	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-282	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-283	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-284	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-285	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-286	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-287	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-288	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-289	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-290	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-291	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H

5-292	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-293	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-294	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-295	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-296	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-297	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-298	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-299	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-300	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-301	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-302	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-303	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-304	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-305	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-306	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-307	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-308	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-309	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-310	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-311	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-312	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-313	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-314	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-315	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-316	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-317	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-318	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-319	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Np(1)}$	H	H	H	H
5-320	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-Np(2)}$	H	H	H	H

5-321	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-cHx$	H	H	H	H
5-322	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-cHx$	H	H	H	H
5-323	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_7-cHx$	H	H	H	H
5-324	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_7-cHx$	H	H	H	H
5-325	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
5-326	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-327	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-328	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-329	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H
5-330	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
5-331	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-332	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-cHx-cHx)$	H	H	H	H
5-333	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-334	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H	H	H
5-335	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H	H	H
5-336	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H	H	H
5-337	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H	H	H
5-338	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-339	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-340	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-341	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
5-342	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
5-343	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
5-344	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
5-345	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-cHx-Ph)$	H	H	H	H
5-346	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-(4-Ph-Ph)$	H	H	H	H
5-347	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8-cHx$	H	H	H	H
5-348	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_8-cHx$	H	H	H	H
5-349	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_8-cHx$	H	H	H	H

5-350	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -cHx	H	H	H	H
5-351	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-352	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-353	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-354	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-355	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-356	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-357	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-358	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-359	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-360	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H	H	H
5-361	H	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H	H	H
5-362	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H	H	H
5-363	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -Ph	H	H	H	H
5-364	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-365	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-366	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-367	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-368	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-369	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-370	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-371	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-372	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-373	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-374	H	Me	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-375	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-376	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-377	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-378	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-379	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-380	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-381	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H
5-382	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
5-383	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-384	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-cHx-cHx)$	H	H	H	H
5-385	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-386	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-Ph$	H	H	H	H
5-387	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-O-Ph$	H	H	H	H
5-388	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-Ph$	H	H	H	H
5-389	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-Ph$	H	H	H	H
5-390	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-391	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-392	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-393	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
5-394	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
5-395	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
5-396	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
5-397	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-cHx-Ph)$	H	H	H	H
5-398	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Ph-Ph)$	H	H	H	H
5-399	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cPn$	H	H	H	H
5-400	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	H	H	H
5-401	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	Me	H	H	H
5-402	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	Me	H	H
5-403	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	F	H	H	H
5-404	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	F	H	H
5-405	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	H	H	H
5-406	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	H	H	H
5-407	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-cHx$	H	H	H	H

5-408	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-409	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-410	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Cl-cHx})$	H	H	H	H
5-411	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Br-cHx})$	H	H	H	H
5-412	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-413	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-414	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-415	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-416	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-417	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-418	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H
5-419	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-420	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-421	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-422	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-423	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-424	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-425	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-426	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-427	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-428	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-429	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-430	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-431	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[3\text{-(2-Et-PrO)-cHx}]$	H	H	H	H
5-432	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[4\text{-(2-Et-PrO)-cHx}]$	H	H	H	H
5-433	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-434	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-435	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-436	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H

5-437	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-438	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-439	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-440	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-441	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-442	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-443	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-444	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-445	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-446	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-447	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-448	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-449	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-450	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-451	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-452	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-453	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-454	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-455	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	Me	H	H	H
5-456	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	Me	H	H
5-457	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	F	H	H	H
5-458	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	F	H	H
5-459	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-460	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-461	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-462	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-463	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-464	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-465	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-0-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H



5-466	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-467	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-468	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-469	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-470	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-471	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-472	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-473	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-474	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-475	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-476	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-477	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-478	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-479	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-480	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-481	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-482	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-483	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-484	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-485	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-486	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[3\text{-(2-Et-PrO)-Ph}]$	H	H	H	H
5-487	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}[4\text{-(2-Et-PrO)-Ph}]$	H	H	H	H
5-488	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-489	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-490	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-491	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-492	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-493	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-494	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H

5-495	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-PrS-Ph)}$	H	H	H	H
5-496	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-iPrS-Ph)}$	H	H	H	H
5-497	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-iPrS-Ph)}$	H	H	H	H
5-498	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]}$	H	H	H	H
5-499	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]}$	H	H	H	H
5-500	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-iBuS-Ph)}$	H	H	H	H
5-501	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-iBuS-Ph)}$	H	H	H	H
5-502	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-cHx-Ph)}$	H	H	H	H
5-503	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-cHx-Ph)}$	H	H	H	H
5-504	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3-Ph-Ph)}$	H	H	H	H
5-505	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(4-Ph-Ph)}$	H	H	H	H
5-506	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(2,4-diMe-Ph)}$	H	H	H	H
5-507	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,4-diMe-Ph)}$	H	H	H	H
5-508	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-(3,5-diMe-Ph)}$	H	H	H	H
5-509	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-O-cHx}$	H	H	H	H
5-510	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-O-Ph}$	H	H	H	H
5-511	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-O-cHx}$	H	H	H	H
5-512	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-O-Ph}$	H	H	H	H
5-513	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-514	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-515	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-516	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-517	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-F-cHx)}$	H	H	H	H
5-518	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H	H	H
5-519	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-Et-cHx)}$	H	H	H	H
5-520	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H	H	H
5-521	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeO-cHx)}$	H	H	H	H
5-522	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-EtO-cHx)}$	H	H	H	H
5-523	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-OCH}_2\text{-(4-MeS-cHx)}$	H	H	H	H

5-524	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-525	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-526	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-527	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-528	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-529	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-530	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-531	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-532	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-533	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-534	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-535	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-536	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-537	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-538	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-539	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cPn}$	H	H	H	H
5-540	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-541	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	Me	H	H	H
5-542	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	Me	H	H
5-543	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	F	H	H	H
5-544	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	F	H	H
5-545	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-546	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-547	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-548	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-549	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-550	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-551	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-552	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H

5-553	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-554	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-555	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-556	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-557	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-558	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H
5-559	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-560	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-561	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-562	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-563	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-564	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-565	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-566	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-567	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-568	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-569	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-570	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-571	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-572	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-573	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-574	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-575	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-576	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-577	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-578	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-579	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-580	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-581	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H

5-582	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-iPrS-cHx)$	H	H	H	H
5-583	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)-cHx]$	H	H	H	H
5-584	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)-cHx]$	H	H	H	H
5-585	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-iBuS-cHx)$	H	H	H	H
5-586	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-iBuS-cHx)$	H	H	H	H
5-587	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-cHx-cHx)$	H	H	H	H
5-588	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-cHx-cHx)$	H	H	H	H
5-589	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-590	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-Ph-cHx)$	H	H	H	H
5-591	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(2,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-592	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-593	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-594	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	H	H	H
5-595	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	Me	H	H	H
5-596	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	Me	H	H
5-597	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	F	H	H	H
5-598	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	F	H	H
5-599	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	H	H	H
5-600	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	H	H	H
5-601	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	H	H	H
5-602	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-F-Ph)$	H	H	H	H
5-603	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-604	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
5-605	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
5-606	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-607	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-608	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-609	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-610	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-(3-Pr-Ph)$	H	H	H	H

5-611	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-612	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-613	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-614	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-615	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-616	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-617	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-618	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-619	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-620	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-621	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-622	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-623	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-624	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-625	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-626	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-627	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-628	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-629	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-630	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-631	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-632	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-633	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-634	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-635	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-636	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-637	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-638	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-639	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H

5-640	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-641	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-642	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-643	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-644	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-645	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-646	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-647	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-648	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-649	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-650	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-651	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-652	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-653	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-654	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-655	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-656	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-657	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-658	H	Me	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-659	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-660	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-661	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-F-cHx)}$	H	H	H	H
5-662	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H	H	H
5-663	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-Et-cHx)}$	H	H	H	H
5-664	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-CF}_3\text{-cHx)}$	H	H	H	H
5-665	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-MeO-cHx)}$	H	H	H	H
5-666	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-EtO-cHx)}$	H	H	H	H
5-667	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-MeS-cHx)}$	H	H	H	H
5-668	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}\text{-(CH}_2)_3\text{-(4-cHx-cHx)}$	H	H	H	H

5-669	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-670	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-671	H	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-672	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-673	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-674	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-675	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-676	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-677	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-678	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-679	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-680	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-681	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-682	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-683	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-684	H	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-685	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-686	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-687	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-688	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-689	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-690	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-691	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-692	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-693	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-694	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-695	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-696	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-697	H	Me	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H



## 201

5-698	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-699	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-700	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-701	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-702	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-703	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-704	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-705	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-706	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-707	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-708	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-709	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-710	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-711	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
5-712	H	H	Me	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	H	H
5-713	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-714	H	H	Me	2	-C=C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-715	H	H	Me	2	-C=C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-716	H	H	Me	2	-C=C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-717	H	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H	H	H
5-718	H	Me	Me	2	-C≡C-cHx	H	H	H	H
5-719	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H	H	H
5-720	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H	H	H
5-721	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-722	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-723	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-724	H	H	Me	2	-C≡C-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-725	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-726	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H

5-727	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-728	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-729	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-730	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-731	H	Me	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-732	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-733	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-734	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-735	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-736	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-737	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-738	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-739	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-740	H	H	Me	2	-C≡C-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-741	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-742	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-743	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-744	H	Me	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-745	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-746	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-747	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-748	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-749	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-750	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-751	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-752	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-753	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-754	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-755	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H

5-756	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-757	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-758	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-759	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-760	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-761	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-762	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-763	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-764	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-765	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-766	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-767	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-768	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-769	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cPn}$	H	H	H	H
5-770	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-771	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	Me	H	H	H
5-772	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	Me	H	H
5-773	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	F	H	H	H
5-774	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	F	H	H
5-775	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-776	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-777	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-778	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-779	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-780	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-781	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-782	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-783	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-784	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H

5-785	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-786	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-787	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-788	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H
5-789	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-790	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-791	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-792	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-793	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-794	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-795	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-796	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-797	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-798	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-799	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-800	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-801	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-802	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-803	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-804	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-805	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-806	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-807	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-808	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-809	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-810	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-811	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-812	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-813	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H

5-814	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrS})-\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-815	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-816	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-817	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-818	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-819	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-820	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-821	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-822	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-823	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-824	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-825	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	Me	H	H	H
5-826	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	Me	H	H
5-827	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	F	H	H	H
5-828	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	F	H	H
5-829	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-830	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-831	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-832	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-833	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-834	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-835	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-836	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-837	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-838	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-839	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-840	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-841	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-842	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H

5-843	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-844	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-845	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-846	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-847	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-848	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-849	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-850	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-851	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-852	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-853	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-854	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-855	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-856	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-857	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-858	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-859	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-860	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-861	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-862	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-863	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-864	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-865	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-866	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-867	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-868	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-869	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-870	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-871	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H

5-872	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-873	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-874	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-875	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-876	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-877	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-878	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-879	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Np (1)}$	H	H	H	H
5-880	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Np (2)}$	H	H	H	H
5-881	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cPn}$	H	H	H	H
5-882	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-883	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	Me	H	H	H
5-884	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	Me	H	H
5-885	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	F	H	H	H
5-886	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	F	H	H
5-887	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-888	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-889	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-890	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-891	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-892	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H	H	H
5-893	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-cHx})$	H	H	H	H
5-894	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-895	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-896	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-897	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-898	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-899	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-900	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H

5-901	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-902	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-903	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-904	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-905	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-906	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-907	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-908	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-909	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-910	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-911	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-912	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-913	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-914	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-915	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-916	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-917	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-918	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-919	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-920	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-921	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-922	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-923	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-924	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-925	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-926	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-cHx}]$	H	H	H	H
5-927	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-928	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-929	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H



5-930	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-931	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-932	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-933	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-934	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-935	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-936	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-937	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	Me	H	H	H
5-938	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	Me	H	H
5-939	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	F	H	H	H
5-940	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	F	H	H
5-941	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-942	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-943	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-944	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-945	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-946	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-947	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-948	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-949	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-950	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-951	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-952	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-953	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-954	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-955	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-956	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-957	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-958	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H

5-959	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-960	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-961	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-962	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-963	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-964	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-965	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-966	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-967	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-968	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-969	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-970	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-971	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-972	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-973	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-974	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-975	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-976	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-977	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-978	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-979	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-980	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-981	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-982	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-983	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-984	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-985	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-986	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-987	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H

5-988	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-989	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-990	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-991	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Np (1)}$	H	H	H	H
5-992	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Np (2)}$	H	H	H	H
5-993	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-994	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-995	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-996	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-997	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-998	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-999	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-1000	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-1001	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-1002	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-1003	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1004	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-1005	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-1006	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1007	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1008	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1009	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1010	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-1011	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1012	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1013	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1014	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1015	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1016	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H

5-1017	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1018	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1019	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1020	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1021	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1022	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1023	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-1024	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-1025	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-1026	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-1027	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-1028	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-1029	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1030	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-1031	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-1032	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1033	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1034	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1035	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1036	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-1037	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1038	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1039	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1040	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1041	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1042	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1043	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1044	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1045	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C-CH}_2\text{-O-cHx}$	H	H	H	H

5-1046	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1047	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1048	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1049	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1050	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1051	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1052	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1053	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1054	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1055	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1056	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1057	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1058	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1059	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1060	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1061	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1062	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1063	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1064	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1065	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1066	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1067	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1068	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1069	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1070	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1071	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cPn}$	H	H	H	H
5-1072	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1073	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	Me	H	H	H
5-1074	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	Me	H	H

5-1075	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	F	H	H	H
5-1076	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	F	H	H
5-1077	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1078	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1079	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1080	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1081	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1082	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1083	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1084	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1085	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1086	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1087	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1088	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1089	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1090	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1091	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1092	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1093	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1094	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1095	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1096	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1097	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1098	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1099	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1100	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1101	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1102	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1103	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})-\text{cHx}]$	H	H	H	H

5-1104	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2\text{-Et-PrO})-\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1105	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-1106	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iBuO-cHx})$	H	H	H	H
5-1107	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1108	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1109	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-1110	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtS-cHx})$	H	H	H	H
5-1111	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-1112	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrS-cHx})$	H	H	H	H
5-1113	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-1114	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrS-cHx})$	H	H	H	H
5-1115	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2\text{-Et-PrS})-\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1116	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2\text{-Et-PrS})-\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1117	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-1118	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iBuS-cHx})$	H	H	H	H
5-1119	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-1120	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-1121	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-1122	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-1123	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1124	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1125	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1126	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-1127	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	Me	H	H	H
5-1128	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	Me	H	H
5-1129	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	F	H	H	H
5-1130	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	F	H	H
5-1131	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-1132	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H

5-1133	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-1134	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1135	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1136	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1137	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1138	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1139	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1140	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1141	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1142	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1143	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1144	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1145	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1146	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1147	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1148	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1149	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1150	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1151	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1152	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1153	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1154	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1155	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1156	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1157	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1158	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1159	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1160	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1161	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H



5-1162	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1163	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1164	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-1165	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-1166	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1167	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1168	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1169	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1170	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-1171	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{-Ph}]$	H	H	H	H
5-1172	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-1173	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-1174	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1175	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1176	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1177	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1178	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1179	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1180	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1181	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{O-cHx}$	H	H	H	H
5-1182	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-1183	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{O-cHx}$	H	H	H	H
5-1184	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-1185	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1186	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1187	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1188	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1189	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-(4-F-cHx)}$	H	H	H	H
5-1190	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-(4-Me-cHx)}$	H	H	H	H

5-1191	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-1192	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-1193	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-1194	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-1195	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1196	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-cHx})$	H	H	H	H
5-1197	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-cHx})$	H	H	H	H
5-1198	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1199	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1200	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1201	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1202	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-1203	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1204	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1205	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1206	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1207	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1208	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1209	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1210	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1211	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cPn}$	H	H	H	H
5-1212	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1213	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	Me	H	H	H
5-1214	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	Me	H	H
5-1215	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	F	H	H	H
5-1216	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	F	H	H
5-1217	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-CH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1218	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1219	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H

5-1220	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1221	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1222	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1223	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1224	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1225	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1226	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1227	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1228	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1229	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1230	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1231	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1232	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1233	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1234	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1235	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1236	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1237	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1238	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1239	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1240	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1241	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1242	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1243	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrO})\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1244	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrO})\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1245	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1246	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1247	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1248	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H

5-1249	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{EtS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1250	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{EtS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1251	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{PrS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1252	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{PrS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1253	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{iPrS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1254	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iPrS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1255	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2-\text{Et}-\text{PrS})\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1256	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2-\text{Et}-\text{PrS})\text{cHx}]$	H	H	H	H
5-1257	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{iBuS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1258	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{iBuS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1259	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1260	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1261	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1262	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1263	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(2,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1264	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1265	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1266	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1267	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	Me	H	H	H
5-1268	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	Me	H	H
5-1269	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	F	H	H	H
5-1270	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	F	H	H
5-1271	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1272	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1273	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1274	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1275	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1276	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Cl}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1277	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4-\text{Br}-\text{Ph})$	H	H	H	H

5-1278	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1279	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1280	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1281	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1282	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-1283	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-1284	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-1285	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-1286	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-1287	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-1288	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1289	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1290	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1291	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1292	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1293	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1294	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1295	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1296	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1297	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1298	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrO})\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-1299	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrO})\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-1300	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-1301	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuO-Ph})$	H	H	H	H
5-1302	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1303	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1304	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-1305	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-EtS-Ph})$	H	H	H	H
5-1306	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-PrS-Ph})$	H	H	H	H

5-1307	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-PrS-Ph})$ ,	H	H	H	H
5-1308	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1309	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iPrS-Ph})$	H	H	H	H
5-1310	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[3-(2\text{-Et-PrS})\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-1311	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-[4-(2\text{-Et-PrS})\text{Ph}]$	H	H	H	H
5-1312	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-1313	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-iBuS-Ph})$	H	H	H	H
5-1314	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1315	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1316	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1317	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1318	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1319	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1320	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1321	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1322	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1323	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1324	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1325	H	H	Me	2	$-\text{CO}-\text{CH}_2-(4\text{-cHx-Ph})$	H	H	H	H
5-1326	H	H	Me	2	$-\text{CO}-\text{CH}_2-(4\text{-Ph-Ph})$	H	H	H	H
5-1327	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1328	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1329	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1330	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1331	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1332	H	Me	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1333	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1334	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1335	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H

5-1336	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1337	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1338	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1339	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1340	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1341	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1342	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1343	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1344	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1345	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1346	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1347	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1348	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1349	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1350	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1351	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1352	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1353	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1354	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1355	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1356	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1357	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1358	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1359	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1360	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1361	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1362	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1363	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1364	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H

5-1365	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1366	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1367	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1368	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1369	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1370	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1371	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1372	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1373	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1374	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1375	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1376	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1377	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1378	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1379	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1380	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1381	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1382	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1383	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1384	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1385	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1386	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1387	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1388	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1389	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1390	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1391	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1392	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1393	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H



5-1394	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1395	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1396	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1397	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1398	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1399	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1400	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1401	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1402	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1403	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1404	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1405	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1406	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1407	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1408	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1409	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1410	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1411	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1412	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1413	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cPn	H	H	H	H
5-1414	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1415	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	Me	H	H	H
5-1416	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	Me	H	H
5-1417	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	F	H	H	H
5-1418	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	F	H	H
5-1419	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1420	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1421	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1422	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-cHx)	H	H	H	H

5-1423	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1424	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1425	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1426	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1427	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1428	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1429	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1430	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1431	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1432	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1433	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1434	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1435	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1436	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1437	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1438	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1439	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1440	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1441	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1442	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1443	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1444	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1445	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1446	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1447	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1448	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1449	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1450	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1451	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H

5-1452	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1453	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1454	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1455	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1456	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1457	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS) cHx]	H	H	H	H
5-1458	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS) cHx]	H	H	H	H
5-1459	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1460	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1461	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1462	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1463	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1464	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1465	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2, 4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1466	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3, 4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1467	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3, 5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1468	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1469	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	Me	H	H	H
5-1470	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	Me	H	H
5-1471	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	F	H	H	H
5-1472	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	F	H	H
5-1473	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1474	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1475	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1476	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1477	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1478	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1479	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1480	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Me-Ph)	H	H	H	H

5-1481	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1482	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1483	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1484	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1485	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1486	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1487	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1488	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1489	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1490	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1491	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1492	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1493	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1494	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1495	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1496	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1497	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1498	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1499	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1500	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1501	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1502	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1503	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1504	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1505	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1506	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1507	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1508	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1509	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H

5-1510	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1511	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1512	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1513	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1514	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1515	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1516	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1517	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1518	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1519	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1520	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1521	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1522	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1523	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1524	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1525	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-cHx	H	H	H	H
5-1526	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -O-Ph	H	H	H	H
5-1527	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1528	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1529	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1530	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1531	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1532	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1533	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1534	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1535	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1536	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1537	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1538	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-1539	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1540	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1541	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1542	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1543	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1544	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1545	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1546	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1547	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1548	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1549	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1550	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1551	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1552	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1553	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -cPn	H	H	H	H
5-1554	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1555	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	Me	H	H	H
5-1556	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	Me	H	H
5-1557	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	F	H	H	H
5-1558	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	F	H	H
5-1559	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1560	COMe	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1561	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1562	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-1563	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1564	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1565	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1566	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1567	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-1568	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1569	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1570	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1571	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1572	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1573	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1574	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1575	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1576	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1577	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1578	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1579	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1580	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1581	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1582	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1583	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1584	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1585	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1586	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1587	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1588	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1589	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1590	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1591	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1592	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1593	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1594	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1595	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1596	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H

5-1597	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H		
5-1598	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H		
5-1599	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1600	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1601	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1602	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1603	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1604	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1605	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1606	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1607	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1608	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1609	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	Me	H	H	H
5-1610	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	Me	H	H
5-1611	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	F	H	H	H
5-1612	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	F	H	H
5-1613	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1614	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1615	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1616	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1617	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1618	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1619	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1620	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1621	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1622	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1623	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1624	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1625	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Pr-Ph)	H	H	H	H



5-1626	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1627	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1628	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1629	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1630	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1631	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1632	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1633	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1634	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1635	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1636	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1637	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1638	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1639	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1640	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1641	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1642	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1643	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1644	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1645	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1646	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1647	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1648	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1649	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1650	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1651	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1652	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1653	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1654	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H

5-1655	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1656	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1657	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1658	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1659	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1660	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1661	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1662	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>2</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1663	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1664	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1665	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1666	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -OCH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1667	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1668	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1669	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1670	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1671	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1672	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1673	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1674	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1675	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1676	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1677	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1678	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1679	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1680	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1681	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1682	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1683	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-1684	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1685	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1686	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1687	H	Me	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1688	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1689	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-1690	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1691	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1692	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1693	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1694	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1695	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1696	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1697	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{cHx}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1698	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Ph}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-1699	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1700	H	Me	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1701	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1702	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-1703	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1704	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1705	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1706	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1707	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1708	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1709	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1710	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{cHx}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1711	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Ph}-\text{cHx})$	H	H	H	H
5-1712	H	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H

5-1713	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1714	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1715	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1716	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1717	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1718	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1719	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-1720	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1721	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1722	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1723	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1724	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1725	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1726	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1727	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1728	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1729	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-1730	H	Me	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-1731	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-1732	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-1733	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-F-Ph	H	H	H	H
5-1734	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-F-Ph	H	H	H	H
5-1735	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diF-Ph	H	H	H	H
5-1736	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Cl-Ph	H	H	H	H
5-1737	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Cl-Ph	H	H	H	H
5-1738	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diCl-Ph	H	H	H	H
5-1739	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2-Me-Ph	H	H	H	H
5-1740	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-3-Me-Ph	H	H	H	H
5-1741	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)-2,3-diMe-Ph	H	H	H	H

5-1742	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H	H	H
5-1743	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]Ph	H	H	H	H
5-1744	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1745	H	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1746	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1747	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1748	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
5-1749	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1750	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	H	H
5-1751	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1752	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1753	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-1754	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1755	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1756	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1757	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H	H	H
5-1758	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H	H	H
5-1759	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1760	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1761	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1762	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1763	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cPn	H	H	H	H
5-1764	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1765	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	Me	H	H	H
5-1766	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	Me	H	H
5-1767	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	F	H	H	H
5-1768	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	F	H	H
5-1769	H	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1770	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H

5-1771	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1772	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1773	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1774	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1775	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1776	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1777	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1778	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1779	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1780	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1781	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1782	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1783	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1784	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1785	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1786	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1787	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1788	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1789	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1790	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	Me	H	H	H
5-1791	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	Me	H	H
5-1792	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	F	H	H	H
5-1793	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	F	H	H
5-1794	H	Me	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1795	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1796	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1797	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1798	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1799	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(4-Br-Ph)	H	H	H	H

5-1800	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1801	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1802	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-1803	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-1804	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-1805	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1806	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1807	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1808	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1809	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1810	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1811	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1812	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1813	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1814	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1815	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cPn}$	H	H	H	H
5-1816	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1817	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	Me	H	H	H
5-1818	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	Me	H	H
5-1819	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	F	H	H	H
5-1820	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	F	H	H
5-1821	H	Me	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1822	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1823	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1824	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-1825	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H	H	H
5-1826	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-cHx})$	H	H	H	H
5-1827	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
5-1828	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H

5-1829	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-1830	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
5-1831	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Bu-cHx)$	H	H	H	H
5-1832	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-1833	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H
5-1834	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
5-1835	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-PrO-cHx)$	H	H	H	H
5-1836	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-iPrO-cHx)$	H	H	H	H
5-1837	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-1838	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-1839	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(2,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1840	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1841	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1842	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
5-1843	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	Me	H	H	H
5-1844	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	Me	H	H
5-1845	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	F	H	H	H
5-1846	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	F	H	H
5-1847	H	Me	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
5-1848	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
5-1849	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
5-1850	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-1851	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
5-1852	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
5-1853	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
5-1854	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
5-1855	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Pr-Ph)$	H	H	H	H
5-1856	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-iPr-Ph)$	H	H	H	H
5-1857	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-Bu-Ph)$	H	H	H	H



5-1858	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1859	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1860	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1861	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1862	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1863	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1864	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1865	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(2, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1866	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3, 4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1867	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3, 5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1868	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1869	H	H	Et	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1870	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH-cHx}$	H	H	H	H
5-1871	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH-Ph}$	H	H	H	H
5-1872	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1873	H	Me	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1874	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1875	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1876	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1877	H	Me	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1878	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1879	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1880	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1881	H	Me	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1882	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1883	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1884	H	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1885	H	Me	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1886	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H

5-1887	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1888	H	H	Et	2	-CH=CH-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-1889	H	H	Et	2	-CH=CH-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-1890	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-1891	H	H	Et	2	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-1892	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1893	H	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1894	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1895	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1896	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1897	H	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1898	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1899	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1900	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1901	H	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1902	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1903	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1904	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1905	H	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1906	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1907	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1908	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cPn	H	H	H	H
5-1909	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1910	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	Me	H	H	H
5-1911	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	Me	H	H
5-1912	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	F	H	H	H
5-1913	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	F	H	H
5-1914	H	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1915	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H

5-1916	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-1917	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1918	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1919	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1920	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1921	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1922	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1923	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1924	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1925	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-1926	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1927	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1928	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1929	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1930	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1931	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1932	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1933	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1934	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1935	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1936	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	Me	H	H	H
5-1937	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	Me	H	H
5-1938	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	F	H	H	H
5-1939	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	F	H	H
5-1940	H	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1941	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1942	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-1943	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1944	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H

5-1945	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-1946	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1947	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-1948	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-1949	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-1950	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-1951	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-1952	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-1953	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-1954	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1955	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-1956	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1957	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-1958	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1959	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1960	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-1961	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cPn}$	H	H	H	H
5-1962	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1963	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	Me	H	H	H
5-1964	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	Me	H	H
5-1965	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	F	H	H	H
5-1966	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	F	H	H
5-1967	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1968	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1969	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-1970	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
5-1971	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H	H	H
5-1972	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-cHx})$	H	H	H	H
5-1973	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H

5-1974	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
5-1975	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
5-1976	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H
5-1977	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
5-1978	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
5-1979	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
5-1980	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
5-1981	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
5-1982	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
5-1983	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
5-1984	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1985	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1986	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-1987	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1988	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	Me	H	H	H
5-1989	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	Me	H	H
5-1990	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	F	H	H	H
5-1991	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	F	H	H
5-1992	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1993	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1994	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-1995	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-1996	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-1997	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-1998	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-1999	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-2000	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-2001	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-2002	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H

5-2003	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2004	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2005	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2006	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2007	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2008	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2009	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2010	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(2,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2011	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2012	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
5-2013	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2014	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2015	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2016	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2017	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2018	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2019	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2020	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2021	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2022	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2023	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2024	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2025	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2026	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2027	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2028	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2029	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2030	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2031	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H

5-2032	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2033	H	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2034	H	Me	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2035	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2036	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2037	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cPn	H	H	H	H
5-2038	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2039	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	Me	H	H	H
5-2040	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	Me	H	H
5-2041	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	F	H	H	H
5-2042	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	F	H	H
5-2043	H	Me	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2044	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2045	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2046	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-2047	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-2048	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-2049	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-2050	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-2051	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-2052	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-2053	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-2054	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -cHx)	H	H	H	H
5-2055	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-2056	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-2057	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-2058	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-2059	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-2060	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-2061	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-2062	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-2063	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
5-2064	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-2065	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	Me	H	H	H
5-2066	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	Me	H	H
5-2067	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	F	H	H	H
5-2068	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	F	H	H
5-2069	H	Me	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2070	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-2071	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
5-2072	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2073	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2074	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
5-2075	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2076	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-2077	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
5-2078	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
5-2079	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
5-2080	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2081	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2082	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
5-2083	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
5-2084	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
5-2085	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
5-2086	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2087	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2088	H	H	Et	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2089	H	H	Et	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H



5-2090	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2091	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2092	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2093	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2094	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2095	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2096	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2097	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2098	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2099	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2100	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2101	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2102	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2103	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2104	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2105	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2106	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2107	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2108	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2109	H	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2110	H	Me	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2111	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2112	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2113	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2114	H	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2115	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2116	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2117	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2118	H	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H

5-2119	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2120	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2121	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2122	H	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2123	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2124	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2125	H	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2126	H	Me	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2127	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2128	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2129	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2130	H	Me	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2131	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2132	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2133	H	H	Et	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H	H	H
5-2134	H	H	Et	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]Ph	H	H	H	H
5-2135	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2136	H	Me	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2137	CO <sub>2</sub> Me	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2138	CO <sub>2</sub> Et	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2139	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
5-2140	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2141	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2142	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2143	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2144	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2145	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2146	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2147	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	H	H

5-2148	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H	H	H
5-2149	H	H	Et	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H	H	H
5-2150	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2151	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2152	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2153	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2154	H	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2155	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2156	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2157	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2158	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2159	CO <sub>2</sub> Me	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2160	CO <sub>2</sub> Et	H	Pr	2	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2161	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2162	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2163	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2164	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2165	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2166	H	H	Me	3	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2167	H	H	Me	3	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2168	H	H	Me	3	-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2169	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2170	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2171	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2172	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2173	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2174	H	H	Me	3	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2175	H	H	Me	3	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2176	H	H	Me	3	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H

5-2177	H	H	Me	3	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
5-2178	H	H	Me	3	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2179	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cPn	H	H	H	H
5-2180	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cPn	H	H	H	H
5-2181	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2182	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
5-2183	H	H	Me	3	-C≡C-CH <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2184	H	H	Me	3	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
5-2185	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2186	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2187	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2188	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2189	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2190	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2191	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2192	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2193	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2194	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2195	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2196	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2197	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2198	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2199	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2200	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2201	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2202	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2203	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2204	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2205	H	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H

5-2206	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2207	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2208	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2209	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2210	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2211	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2212	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2213	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2214	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2215	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2216	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2217	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2218	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2219	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2220	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2221	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2222	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2223	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2224	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2225	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2226	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2227	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2228	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2229	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2230	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3\text{-O-}(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2231	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2232	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2233	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2234	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-O-}(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H

5-2235	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2236	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2237	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{O}-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2238	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2239	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2240	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2241	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2242	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2243	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2244	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2245	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2246	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2247	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2248	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2249	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2250	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2251	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2252	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2253	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2254	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2255	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2256	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2257	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2258	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2259	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2260	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2261	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2262	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2263	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H

5-2264	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2265	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2266	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2267	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2268	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2269	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2270	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2271	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2272	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2273	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2274	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2275	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2276	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2277	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(2,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2278	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2279	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2280	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2281	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2282	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2283	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2284	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2285	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2286	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2287	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2288	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2289	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-O}-(4\text{-CO}_2\text{H-Ph})$	H	H	H	H
5-2290	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-O}-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2291	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-O}-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2292	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-O}-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H

5-2293	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2294	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2295	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2296	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2297	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2298	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,5\text{-diMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2299	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3,4,5\text{-triMeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2300	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(3\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2301	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(4\text{-Ac-Ph})$	H	H	H	H
5-2302	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2303	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
5-2304	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2305	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diF-Ph})$	H	H	H	H
5-2306	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2307	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
5-2308	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2309	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCl-Ph})$	H	H	H	H
5-2310	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2311	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
5-2312	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2313	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
5-2314	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-2315	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
5-2316	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2317	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2318	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,4\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2319	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3,5\text{-diCF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
5-2320	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(3\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
5-2321	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H



5-2322	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2323	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2324	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2325	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2326	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2327	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2328	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2329	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2330	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2331	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2332	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2333	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2334	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2335	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2336	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2337	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2338	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2339	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2340	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2341	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2342	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2343	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2344	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2345	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2346	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2347	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2348	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-2349	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2350	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H

5-2351	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2352	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2353	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2354	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2355	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2356	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2357	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2358	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2359	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2360	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2361	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2362	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2363	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2364	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2365	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2366	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2367	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2368	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2369	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2370	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2371	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2372	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2373	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2374	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2375	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2376	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2377	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2378	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2379	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H

5-2380	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2381	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2382	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2383	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2384	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2385	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diCF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
5-2386	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2387	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2388	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2389	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2390	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2391	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2392	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2393	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2394	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2395	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2396	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2397	H	H	Me	2	-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2398	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2399	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2400	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2401	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2402	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2403	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2404	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2405	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2406	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2407	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2408	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H

5-2409	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2410	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2411	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2412	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2413	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2414	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2415	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2416	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2417	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2418	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2419	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2420	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2421	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2422	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2423	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2424	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2425	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2426	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2427	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2428	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2429	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
5-2430	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2431	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2432	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2433	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2434	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2435	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2436	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
5-2437	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H

5-2438	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2439	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2440	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2441	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2442	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2443	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2444	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2445	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2446	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2447	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2448	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2449	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2450	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2451	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2452	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2453	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2454	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2455	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2456	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2457	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2458	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2459	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2460	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2461	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2462	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2463	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2464	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2465	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2466	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H

5-2467	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2468	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2469	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2470	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2471	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2472	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2473	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2474	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2475	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2476	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2477	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2478	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2479	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2480	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2481	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2482	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2483	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2484	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2485	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2486	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2487	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2488	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2489	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2490	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2491	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2492	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2493	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2494	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2495	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H

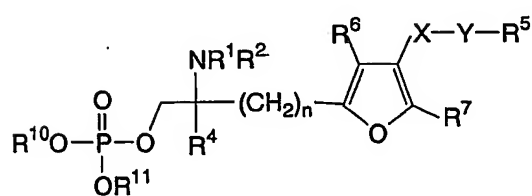
5-2496	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2497	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2498	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2499	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2500	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2501	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2502	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2503	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2504	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2505	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2506	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2507	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2508	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2509	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2510	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2511	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2512	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2513	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2514	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2515	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2516	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2517	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
5-2518	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2519	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2520	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2521	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2522	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2523	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
5-2524	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H

5-2525	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2526	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2527	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2528	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2529	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2530	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2531	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2532	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2533	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2534	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2535	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2536	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2537	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2538	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2539	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2540	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2541	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2542	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2543	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2544	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2545	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2546	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2547	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2548	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2549	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
5-2550	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2551	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2552	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2553	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H

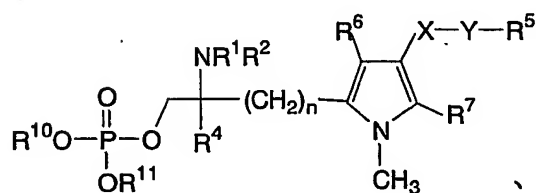


5-2554	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2555	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2556	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
5-2557	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{CH}(\text{OH})-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H

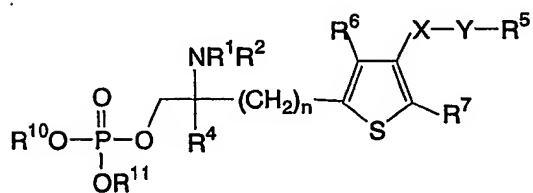
表 6



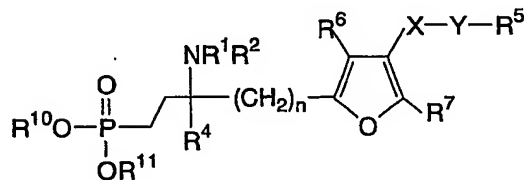
(IIb-1)



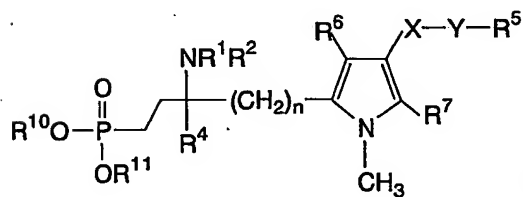
(IIb-2)



(IIb-3)

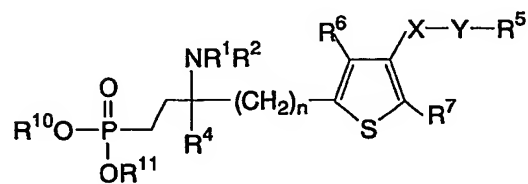


(IIIb-1)



(IIIb-2)

又は



(IIIb-3)

Compd.	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^4$	$n$	$-\text{Y}-\text{Z}-\text{R}^5$	$\text{R}^6$	$\text{R}^7$	$\text{R}^{10}$	$\text{R}^{11}$
6-1	H	H	Me	1	$-(\text{CH}_2)_5-\text{CHx}$	H	H	H	H

6-2	H	H	Me	1	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-3	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-4	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-5	H	H	Me	1	$-4-(\text{cHx}-\text{CH}_2\text{O})\text{Ph}$	H	H	H	H
6-6	H	H	Me	1	$-(4-\text{BzO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-7	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-8	H	H	Me	1	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-9	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-10	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-11	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-12	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-13	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cPn}$	H	H	H	H
6-14	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-15	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	Me	H	H	H
6-16	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	Me	H	H
6-17	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	F	H	H	H
6-18	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	F	H	H
6-19	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-20	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-21	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-22	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-23	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-24	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-25	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-26	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-27	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-28	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-29	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-30	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H

6-31	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
6-32	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-PrO-cHx)$	H	H	H	H
6-33	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPrO-cHx)$	H	H	H	H
6-34	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-MeS-cHx)$	H	H	H	H
6-35	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H
6-36	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(6-4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-37	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-38	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-39	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-40	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	Me	H	H	H
6-41	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	Me	H	H
6-42	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	F	H	H	H
6-43	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	F	H	H
6-44	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-45	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-46	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-47	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
6-48	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
6-49	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
6-50	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
6-51	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
6-52	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Pr-Ph)$	H	H	H	H
6-53	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPr-Ph)$	H	H	H	H
6-54	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Bu-Ph)$	H	H	H	H
6-55	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
6-56	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
6-57	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
6-58	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-PrO-Ph)$	H	H	H	H
6-59	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPrO-Ph)$	H	H	H	H

6-60	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
6-61	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
6-62	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(6\text{-4-diMe-Ph})$	H	H	H	H
6-63	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
6-64	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
6-65	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cPn}$	H	H	H	H
6-66	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-67	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	Me	H	H	H
6-68	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	Me	H	H
6-69	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	F	H	H	H
6-70	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	F	H	H
6-71	H	Me	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-72	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-73	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-74	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-F-cHx})$	H	H	H	H
6-75	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Cl-cHx})$	H	H	H	H
6-76	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Br-cHx})$	H	H	H	H
6-77	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Me-cHx})$	H	H	H	H
6-78	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Et-cHx})$	H	H	H	H
6-79	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Pr-cHx})$	H	H	H	H
6-80	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPr-cHx})$	H	H	H	H
6-81	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-Bu-cHx})$	H	H	H	H
6-82	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-CF}_3\text{-cHx})$	H	H	H	H
6-83	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeO-cHx})$	H	H	H	H
6-84	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-EtO-cHx})$	H	H	H	H
6-85	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-PrO-cHx})$	H	H	H	H
6-86	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-iPrO-cHx})$	H	H	H	H
6-87	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(3\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H
6-88	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_6-(4\text{-MeS-cHx})$	H	H	H	H

6-89	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(6-4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-90	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-91	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
6-92	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-93	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	Me	H	H	H
6-94	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	Me	H	H
6-95	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	F	H	H	H
6-96	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	F	H	H
6-97	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-98	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-99	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-100	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
6-101	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
6-102	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
6-103	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
6-104	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
6-105	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Pr-Ph)$	H	H	H	H
6-106	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-iPr-Ph)$	H	H	H	H
6-107	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Bu-Ph)$	H	H	H	H
6-108	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
6-109	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
6-110	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
6-111	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-PrO-Ph)$	H	H	H	H
6-112	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-iPrO-Ph)$	H	H	H	H
6-113	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3-MeS-Ph)$	H	H	H	H
6-114	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
6-115	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(6-4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
6-116	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3,4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
6-117	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(3,5-diMe-Ph)$	H	H	H	H

270

6-118	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-119	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_7\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-120	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_8\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-121	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_8\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-122	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-123	H	Me	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-124	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-125	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-126	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-127	H	Me	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-128	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-129	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-130	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-131	H	Me	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-132	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-133	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-134	H	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-135	H	Me	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-136	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-137	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{CH}=\text{CH}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-138	H	H	Me	2	$-\text{C}=\text{C}-\text{CH}_2\text{O-cHx}$	H	H	H	H
6-139	H	H	Me	2	$-\text{C}=\text{C}-\text{CH}_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
6-140	H	H	Me	2	$-\text{C}=\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	H	H	H
6-141	H	H	Me	2	$-\text{C}=\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
6-142	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-143	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-144	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-145	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-146	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{-Ph}$	H	H	H	H

6-147	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-148	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-149	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-150	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-151	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-152	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-153	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-154	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-155	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-156	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-157	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-158	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cPn}$	H	H	H	H
6-159	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-160	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	Me	H	H	H
6-161	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	Me	H	H
6-162	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	F	H	H	H
6-163	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	F	H	H
6-164	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-165	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-166	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-167	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-168	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-169	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-170	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-171	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-172	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-173	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-174	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-175	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H

6-176	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-177	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-178	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-179	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-180	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-181	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-182	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(6-4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-183	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-184	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-185	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-186	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	Me	H	H	H
6-187	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	Me	H	H
6-188	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	F	H	H	H
6-189	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	F	H	H
6-190	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-191	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-192	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-193	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{F}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-194	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Cl}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-195	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Br}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-196	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Me}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-197	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Et}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-198	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Pr}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-199	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{iPr}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-200	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{Bu}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-201	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{CF}_3-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-202	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{MeO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-203	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{EtO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-204	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{PrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H



6-205	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{iPrO}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-206	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-207	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(4-\text{MeS}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-208	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(6-4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-209	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,4-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-210	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-(3,5-\text{diMe}-\text{Ph})$	H	H	H	H
6-211	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cPn}$	H	H	H	H
6-212	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-213	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	Me	H	H	H
6-214	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	Me	H	H
6-215	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	F	H	H	H
6-216	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	F	H	H
6-217	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-218	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-219	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-220	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-221	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-222	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-223	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-224	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-225	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-226	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-227	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-228	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-229	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-230	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-231	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-232	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-233	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H

6-234	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(6-4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
6-235	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
6-236	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-cHx})$	H	H	H	H
6-237	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-238	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	Me	H	H	H
6-239	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	Me	H	H
6-240	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	F	H	H	H
6-241	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	F	H	H
6-242	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-243	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-244	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-245	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-F-Ph})$	H	H	H	H
6-246	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Cl-Ph})$	H	H	H	H
6-247	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Br-Ph})$	H	H	H	H
6-248	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Me-Ph})$	H	H	H	H
6-249	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Et-Ph})$	H	H	H	H
6-250	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Pr-Ph})$	H	H	H	H
6-251	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPr-Ph})$	H	H	H	H
6-252	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-Bu-Ph})$	H	H	H	H
6-253	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-CF}_3\text{-Ph})$	H	H	H	H
6-254	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeO-Ph})$	H	H	H	H
6-255	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-EtO-Ph})$	H	H	H	H
6-256	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-PrO-Ph})$	H	H	H	H
6-257	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-iPrO-Ph})$	H	H	H	H
6-258	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
6-259	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(4\text{-MeS-Ph})$	H	H	H	H
6-260	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(6-4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
6-261	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,4\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H
6-262	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-(3,5\text{-diMe-Ph})$	H	H	H	H

6-263	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-264	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-265	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-266	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-267	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-268	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-269	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-270	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-271	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-272	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-273	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-274	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-275	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-276	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-277	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-278	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_6-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-279	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-280	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-281	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-282	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-283	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-284	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-285	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-286	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-287	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cPn}$	H	H	H	H
6-288	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-289	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	Me	H	H	H
6-290	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	Me	H	H
6-291	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	F	H	H	H

6-292	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	F	H	H
6-293	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-294	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-295	$\text{CO}_2\text{Et}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-296	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{F}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-297	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Cl}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-298	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Br}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-299	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Me}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-300	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Et}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-301	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Pr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-302	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPr}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-303	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{Bu}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-304	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{CF}_3-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-305	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{MeO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-306	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{EtO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-307	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{PrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-308	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{iPrO}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-309	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-310	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(4-\text{MeS}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-311	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(6-4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-312	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,4-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-313	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-(3,5-\text{diMe}-\text{cHx})$	H	H	H	H
6-314	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-315	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	Me	H	H	H
6-316	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	Me	H	H
6-317	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	F	H	H	H
6-318	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	F	H	H
6-319	H	Me	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-320	$\text{CO}_2\text{Me}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H

6-321	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
6-322	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
6-323	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-324	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
6-325	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
6-326	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
6-327	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
6-328	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
6-329	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
6-330	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	H	H	H	H
6-331	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
6-332	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
6-333	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
6-334	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
6-335	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-336	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(6-4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-337	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-338	H	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-339	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-340	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-341	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-342	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-343	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-344	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-345	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-346	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-347	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-348	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-349	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H

6-350	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-351	H	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-352	H	Me	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-353	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-354	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-355	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-356	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-357	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-358	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-359	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-360	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-361	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-362	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-363	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-364	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-365	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-366	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-367	H	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-368	H	Me	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-369	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-370	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-CH(OH)-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -Ph	H	H	H	H
6-371	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-372	H	Me	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-373	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-374	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-375	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]Ph	H	H	H	H
6-376	H	H	Me	2	-4-[cHx-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]Ph	H	H	H	H
6-377	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-378	H	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H

6-379	CO <sub>2</sub> Me	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-380	CO <sub>2</sub> Et	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-381	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
6-382	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
6-383	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diF-Ph)	H	H	H	H
6-384	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-385	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-386	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diCl-Ph)	H	H	H	H
6-387	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
6-388	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
6-389	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-390	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O]-Ph	H	H	H	H
6-391	H	H	Me	2	-4-[Ph-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O]-Ph	H	H	H	H
6-392	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-393	H	H	Et	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
6-394	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
6-395	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-396	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-397	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-398	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
6-399	H	H	Et	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
6-400	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -cHx	H	H	H	H
6-401	H	H	Pr	2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -cHx	H	H	H	H
6-402	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -cHx	H	H	H	H
6-403	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-404	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH <sub>2</sub> O)Ph	H	H	H	H
6-405	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-406	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-cHx	H	H	H	H
6-407	H	H	Pr	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H

6-408	H	H	Me	3	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-409	H	H	Me	3	$-(\text{CH}_2)_6\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-410	H	H	Me	3	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-411	H	H	Me	3	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-412	H	H	Me	3	$-4-(\text{cHx-CH}_2\text{O})\text{Ph}$	H	H	H	H
6-413	H	H	Me	3	$-(4\text{-BzO-Ph})$	H	H	H	H
6-414	H	H	Me	3	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-cHx}$	H	H	H	H
6-415	H	H	Me	3	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O-Ph}$	H	H	H	H
6-416	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-417	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-418	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-419	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-420	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-421	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-422	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-423	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-424	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-425	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-426	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-427	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-428	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-429	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-430	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-431	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
6-432	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-433	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-434	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-435	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
6-436	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H

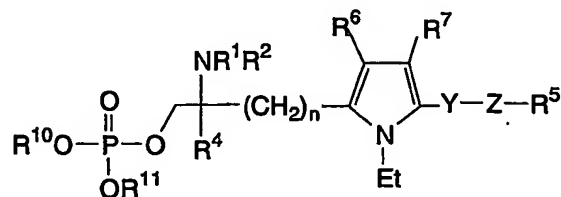


6-437	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-438	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-439	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-440	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-441	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-442	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-443	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-444	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-445	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-446	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-447	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-448	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-449	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-450	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-451	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-452	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-453	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-454	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-455	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-456	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-457	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-458	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-459	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-460	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-461	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-462	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-463	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-464	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-465	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H

6-466	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-467	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-468	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-469	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-470	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-471	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-472	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-473	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-474	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-475	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-476	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-477	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-478	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-479	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-480	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-481	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-482	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-483	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-484	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-485	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-486	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-487	$\text{COC}_8\text{H}_{17}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{cHx}$	H	H	H	H
6-488	$\text{COCH}_3$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-489	$\text{COC}_2\text{H}_5$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-490	$\text{COC}_3\text{H}_7$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-491	$\text{COC}_4\text{H}_9$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-492	$\text{COC}_5\text{H}_{11}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-493	$\text{COC}_6\text{H}_{13}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H
6-494	$\text{COC}_7\text{H}_{15}$	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{Ph}$	H	H	H	H

6-495	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-C≡C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-Ph	H	H	H	H
6-496	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-497	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-498	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-499	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-500	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-501	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-502	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-503	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -cHx	H	H	H	H
6-504	COCH <sub>3</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-505	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-506	COC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-507	COC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-508	COC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-509	COC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-510	COC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H
6-511	COC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	H	Me	2	-CO-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -Ph	H	H	H	H

表 7

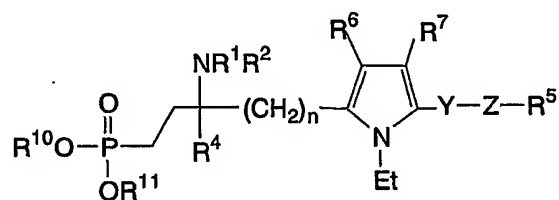


(IIa-4)

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
--------	----------------	----------------	----------------	---	---------------------	----------------	----------------	-----------------	-----------------

7-1	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-2	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
7-3	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-4	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H
7-5	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-6	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	H	H
7-7	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-8	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
7-9	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-10	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3\text{-Ph}$	H	H	H	H
7-11	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
7-12	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H

表 8



(IIIa-4)

Compd.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	n	-Y-Z-R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>
8-1	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-cHx}$	H	H	H	H
8-2	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_4\text{-Ph}$	H	H	H	H
8-3	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-cHx}$	H	H	H	H
8-4	H	H	Me	2	$-(\text{CH}_2)_5\text{-Ph}$	H	H	H	H

8-5	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{cHx}$	H	H	H	H
8-6	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_2-\text{Ph}$	H	H	H	H
8-7	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
8-8	H	H	Me	2	$-\text{C}\equiv\text{C}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
8-9	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{cHx}$	H	H	H	H
8-10	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_3-\text{Ph}$	H	H	H	H
8-11	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{cHx}$	H	H	H	H
8-12	H	H	Me	2	$-\text{CO}-(\text{CH}_2)_4-\text{Ph}$	H	H	H	H

---

上記表 1 [式 (I a-1)、(I a-2) 及び (I a-3)]、表 2 [(I b-1)、(I b-2) 及び (I b-3)]、表 3 [(I a-4)] 並びに表 4 [(I a-5)] において、

本発明の化合物 (I) として好適には、

例示化合物番号：1-21, 1-30~1-46, 1-93~1-152, 1-199~1-253, 1-263~1-272, 1-283~1-298, 1-345~1-401, 1-411~1-426, 1-473~1-528, 1-548~1-549, 1-559~1-574, 1-621~1-680, 1-727~1-781, 1-791~1-801, 1-831~1-836, 1-896~1-949, 1-959~1-974, 1-1021~1-1078, 1-1081~1-1083, 1-1093~1-1103, 1-1113~1-1127, 1-1137~1-1152, 1-1199~1-1255, 1-1265~1-1280, 1-1327~1-1389, 1-1399~1-1409, 1-1419~1-1430, 1-1433, 1-1433~1-1445, 1-1457~1-1466, 1-1484~1-1512, 1-1531~1-1555, 1-1558~1-1565, 1-1584~1-1612, 1-1630~1-1654, 1-1657~1-1664, 1-1683~1-1729, 1-1743~1-1949,  
2-1~2-10, 2-28~2-56, 2-75~2-99, 2-104~2-111, 2-130~2-158, 2-176~2-200, 2-203~2-210, 2-229~2-281,  
4-9~4-12

を挙げることができ、より好適には、

1-21, 1-31~1-38, 1-41~1-46, 1-93~1-105, 1-112~1-117, 1-142~1-144, 1-147~1-152, 1-199~1-211, 1-248~1-250, 1-253, 1-263~1-269, 1-284~1-289, 1-293~1-298, 1-345~1-357, 1-364~1-369, 1-394~1-401, 1-411~1-417, 1-421~1-426, 1-474~1-485, 1-492~1-497, 1-522~1-528, 1-549, 1-559~1-565, 1-568~1-574, 1-621~1-633, 1-640, 1-643, 1-670~1-672, 1-676~1-680, 1-727~1-739, 1-776~1-778, 1-781, 1-831~1-838, 1-842~1-846, 1-893~1-905, 1-912~1-917, 1-942~1-946, 1-949, 1-959~1-965, 1-970~1-974, 1-1021~1-1033, 1-1040~1-1045, 1-1070~1-1073, 1-1081~1-1083, 1-1093~1-1099, 1-1103, 1-1113~1-1119, 1-1148~1-1152, 1-1199~1-1211, 1-1248~1-1252, 1-1265~1-1271, 1-1276~1-1280, 1-1327~1-1339, 1-1376~1-1380, 1-1433, 1-1443~1-1445, 1-1459~1-1466,

1-1484~1-1499, 1-1504~1-1512, 1-1558~1-1565, 1-1584~1-1599, 1-1604~1-1612, 1-1630~1-1639, 1-1657~1-1658, 1-1660~1-1664, 1-1683~1-1692, 1-1702~1-1710, 1-1743~1-1773, 1-1796~1-1846, 1-1848~1-1876, 1-1886~1-1904,

2-3~2-10, 2-28~2-37, 2-52~2-56, 2-75~2-84, 2-88~2-90, 2-95~2-99, 2-104~2-111, 2-130~2-139, 2-143~2-146, 2-150~2-158, 2-176~2-185, 2-189~2-191, 2-196~2-200, 2-203~2-210, 2-229~2-238, 2-242~2-244, 2-248~2-252,

4-9~4-12

を挙げることができ、更に好適には、

1-21, 1-42, 1-93~1-105, 1-112~1-117, 1-142~1-144, 1-147~1-152, 1-199~1-211, 1-248~1-250, 1-294~1-298, 1-351, 1-367, 1-411, 1-549, 1-559~1-565, 1-569~1-574, 1-621~1-633, 1-643, 1-670~1-672, 1-676~1-680, 1-831~1-838, 1-842~1-846, 1-893~1-905, 1-912~1-917, 1-942~1-944, 1-949, 1-1021, 1-1081~1-1083, 1-1093~1-1099, 1-1462, 1-1558~1-1565, 1-1584~1-1599, 1-1604~1-1612, 1-1660~1-1664, 1-1707~1-1710, 1-1762~1-1773, 1-1816~1-1846, 1-1848~1-1859, 1-1886~1-1904,

4-9~4-12

を挙げることができ、更により好適には、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-93: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-570: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-833: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-842: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-628: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-クロロフェニル)ペント-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-640: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-835: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1831: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1838: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1842: 2-アミノ-2-メチル-4-



{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-833: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-842: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-93: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1093: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1890: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1896: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブ

タン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1082: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-2における1-1081: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-5における4-12: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-5における4-11: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-5における4-10: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-5における4-9: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-3における1-21: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-3における1-42: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-3における1-93: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式Ia-3における1-294: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-

オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-351: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-367: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-473: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ペンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-549: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-559: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-570: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-627: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-643: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-833: 2-アミノ-2-メチル-4-{5

－[3－(4－メチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}  
ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-834: 2－アミノ－2－メチル－4－{5  
－[3－(4－エチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}  
ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-838: 2－アミノ－2－メチル－4－{5  
－[3－(4－メチルチオフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－  
イル}ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-842: 2－アミノ－2－メチル－4－[5  
－(4－シクロヘキシルオキシブト－1－イニル)チオフェン－2－イル]ブ  
タン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-899: 2－アミノ－2－メチル－4－{5  
－[4－(4－フルオロフェノキシ)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}  
ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-903: 2－アミノ－2－メチル－4－{5  
－[4－(4－メチルフェノキシ)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}ブ  
タン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-949: 2－アミノ－2－メチル－4－[5  
－(3－シクロヘキシルメトキシプロプ－1－イニル)チオフェン－2－イ  
ル]ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1021: 2－アミノ－2－メチル－4－  
[5－(4－ベンジルオキシブト－1－イニル)チオフェン－2－イル]ブタン  
－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1081: 2－アミノ－2－メチル－4－  
[5－(4－シクロヘキシルブタノイル)チオフェン－2－イル]ブタン－1－  
オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1082: 2－アミノ－2－メチル－4－  
[5－(4－フェニルブタノイル)チオフェン－2－イル]ブタン－1－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1093: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1094: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1462: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1561: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1707: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1831: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1834: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1841: 2-アミノ-2-メチル-4-

{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1842: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1843: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1845: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール及び

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1846: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール

を挙げることができ、特に好適には、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-93: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-570: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-842: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-

オール、

例示化合物番号 式 Ia-1 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-833: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-842: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1093: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1082: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-2 における 1-1081: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-5 における 4-12: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-5 における 4-11: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-5 における 4-10: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-5 における 4-9: 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-21: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-42: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-93: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-294: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-351: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-367: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、



例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-473: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-549: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-559: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-570: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-621: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-627: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-643: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-833: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-834: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-838: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-}

イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-842: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-899: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-903: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-949: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロプ-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1021: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1081: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1082: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1083: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1093: 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1094: 2-アミノ-2-メチル-4-

{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1462: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1561: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1707: 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1831: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1834: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1836: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1841: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1842: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1843: 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン

－２－イル}ブタン－１－オール、

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1845：２－アミノ－２－メチル－４－  
{５－[３－(３－アセチルフェノキシ)プロプ－１－イニル]チオフェン－２－  
イル}ブタン－１－オール及び

例示化合物番号 式 Ia-3 における 1-1846：２－アミノ－２－メチル－４－  
{５－[３－(４－アセチルフェノキシ)プロプ－１－イニル]チオフェン－２－  
イル}ブタン－１－オール

を挙げることができる。

上記表 5 [式 (I I a-1)、(I I a-2) 及び (I I a-3)]、表 6 [(I I b-1)、(I I b-2) 及び (I I b-3)] 並びに表 7 [(I I a-4)]  
において、

本発明の化合物 (I I) として好適には、

例示化合物番号：5-19, 5-23~5-32, 5-36~5-45, 5-49~5-58, 5-62~5-71,  
5-75~5-84, 5-88~5-102, 5-106~5-156, 5-160~5-214, 5-218~5-268,  
5-272~5-321, 5-325~5-334, 5-338~5-347, 5-351~5-360, 5-364~5-373,  
5-377~5-386, 5-390~5-404, 5-408~5-458, 5-462~5-513, 5-517~5-526,  
5-530~5-544, 5-548~5-598, 5-602~5-657, 5-670, 5-674~5-683, 5-696,  
5-700~5-717, 5-721~5-730, 5-734~5-743, 5-747~5-756, 5-760~5-774,  
5-778~5-828, 5-832~5-886, 5-890~5-940, 5-944~5-993, 5-997~5-1006,  
5-1010~5-1019, 5-1045, 5-1049~5-1058, 5-1062~5-1076, 5-1080~5-1130,  
5-1134~5-1185, 5-1189~5-1198, 5-1202~5-1208, 5-1212~5-1216,  
5-1220~5-1270, 5-1274~5-1331, 5-1335~5-1344, 5-1348~5-1357,  
5-1361~5-1370, 5-1374~5-1387, 5-1391~5-1400, 5-1404~5-1418,  
5-1422~5-1472, 5-1476~5-1527, 5-1531~5-1540, 5-1544~5-1558,  
5-1562~5-1612, 5-1616~5-1673, 5-1677~5-1686, 5-1690~5-1699,  
5-1703~5-1712, 5-1716~5-1729, 5-1733~5-1744, 5-1748~5-1768,  
5-1772~5-1793, 5-1797~5-1820, 5-1824~5-1846, 5-1850~5-1869, 5-1872,  
5-1876, 5-1880, 5-1884, 5-1888~5-1892, 5-1896, 5-1900, 5-1908~5-1913,

5-1917~5-1939, 5-1943~5-1966, 5-1970~5-1991, 5-1995~5-2013, 5-2017,  
5- 2021, 5-2025, 5-2029, 5-2033, 5-2037~5-2042, 5-2046~5-2068,  
5-2072~5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2113, 5-2117,  
5-2121, 5-2125, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2139~5-2158, 5-2161~5-2164,  
5-2185~5-2346, 5-2398~5-2557,

6-9~6-18, 6-22~6-43, 6-47~6-70, 6-74~6-96, 6-100~6-119, 6-142,  
6-146, 6-150, 6-154, 6-158~6-163, 6-167~6-183, 6-185~6-189, 6-193  
~6-216, 6-220~6-241, 6-245~6-263, 6-267, 6-271, 6-275, 6-279, 6-283,  
6-287~6-292, 6-296~6-318, 6-322~6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-371,  
6-375~6-377, 6-381~6-407, 6-416~6-511,

7-9~7-12

であり、更に好適には、

5-19, 5-32, 5-36~5-45, 5-57, 5-62~5-71, 5-84, 5-88, 5-97~5-100, 5-152  
~5-154, 5-160~5-214, 5-218~5-227, 5-264~5-268, 5-272~5-321, 5-334,  
5-347, 5-360, 5-373, 5-386, 5-390~5-402, 5-454~5-458, 5-462~5-513,  
5-526, 5-530~5-542, 5-594~5-598, 5-602~5-653, 5-743, 5-756, 5-760  
~5-768, 5-770~5-774, 5-778~5-828, 5-832~5-886, 5-890~5-940, 5-944  
~5-993, 5-1045, 5-1058, 5-1062~5-1074, 5-1126~5-1130, 5-1134~  
5-1185, 5-1198, 5-1202~5-1208, 5-1212~5-1214, 5-1266~5-1270, 5-1274  
~5-1331, 5-1344, 5-1348~5-1357, 5-1370, 5-1374~5-1387, 5-1400,  
5-1404~5-1416, 5-1468~5-1472, 5-1476~5-1527, 5-1540, 5-1544~5-1556,  
5-1608~5-1612, 5-1616~5-1666, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1759~5-1767,  
5-1789~5-1793, 5-1797~5-1818, 5-1842~5-1846, 5-1900, 5-1908~5-1913,  
5-1935~5-1939, 5-1943~5-1966, 5-1987~5-1991, 5-2013, 5-2017, 5-2029,  
5-2033, 5-2037~5-2042, 5-2064~5-2068, 5-2072~5-2089, 5-2093, 5-2097,  
5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2185~5-2346, 5-2398  
~5-2557,

6-11~6-18, 6-39~6-43, 6-47~6-70, 6-185~6-189, 6-193~6-216, 6-287

～6-292, 6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-416～6-511,

7-9～7-12

であり、より好適には、

5-45, 5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-206, 5-209  
～5-212, 5-264～5-266, 5-334, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458,  
5-462～5-485, 5-509, 5-510, 5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598,  
5-602～5-613, 5-649, 5-650, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-772,  
5-824～5-828, 5-832～5-884, 5-936, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074,  
5-1126～5-1130, 5-1134～5-1145, 5-1148～5-1151, 5-1162, 5-1163, 5-1179  
～5-1182, 5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212, 5-1213, 5-1214,  
5-1266～5-1270, 5-1274～5-1285, 5-1288～5-1291, 5-1319～5-1322, 5-1329  
～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1387, 5-1400, 5-1404～  
5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1487, 5-1490～5-1493, 5-1504, 5-1505,  
5-1521～5-1524, 5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616  
～5-1627, 5-1663, 5-1664, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1761～5-1766,  
5-1789～5-1791, 5-1815～5-1818, 5-1900, 5-1909, 5-1962, 5-2064～5-2066,  
5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2133, 5-2216～5-2288, 5-2290  
～5-2346, 5-2398～5-2557,

7-9～7-12

であり、更により好適な化合物は、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-84: リン酸 モノ 2-アミノ-2-  
メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]-1-ブチ  
ル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-770: リン酸 モノ 2-アミノ-2-  
メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-  
イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-824: リン酸 モノ 2-アミノ-2-  
メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]

－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1063：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－メチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1072：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－シクロヘキシルオキシブト－1－イニル)フラン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1331：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペンタノイル)フラン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-2278：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3, 4－ジメチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-834：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[5－(4－クロロフェニル)ペント－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-846：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[5－(3－トリフルオロメチルフェニル)ペント－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1065：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-2273：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－クロロフェノキシ)プロプ－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-2280：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3－トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]フラン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-2284: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-824: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-1063: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-1072: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-2278: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-84: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-1344: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-2332: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-2338: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-1331: リン酸 モノ 2-アミノ-2-



メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1330:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1329:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-12:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-11:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-10:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-9:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-71:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-84:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-98:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]

ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-152: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-210: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-264: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-フェニルヘキシル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-373: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロピル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-386: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フェノキシプロピル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-400: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-454: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェノキシブチル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-509: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンチル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-510: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェノキシペンチル)チオフェン-2-イル] -1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-513: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロピル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-743: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-756: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-770: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-824: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-882: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシ-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-936: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(6-フェニルヘキシ-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1045: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロプ-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1058: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-フェノキシプロプ-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1072: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー４－〔５－（４－シクロヘキシルオキシブト－１－イニル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1126: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（４－フェノキシブト－１－イニル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1181: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（５－シクロヘキシルオキシペント－１－イニル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1182: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（５－フェノキシペント－１－イニル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1185: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（３－シクロヘキシルメトキシプロプ－１－イニル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1329: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（４－シクロヘキシルブタノイル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1330: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（４－フェニルブタノイル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1331: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（５－シクロヘキシルペンタノイル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1344: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（５－フェニルペンタノイル）チオフエンー２－イル〕－１－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1357: リン酸 モノ ２－アミノ－２－メチルー４－〔５－（６－シクロヘキシルヘキサノイル）チオフエンー２－

イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1370: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (6 - フェニルヘキサノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1387: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (3 - シクロヘキシルオキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1400: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (3 - フェノキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1414: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - シクロヘキシルオキシブタノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1468: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - フェノキシブタノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1523: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルオキシペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1524: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェノキシペンタノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1527: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (3 - シクロヘキシルメトキシプロパノイル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1729: リン酸 モノ 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - シクロヘキシルメトキシフェニル) チオフェン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1742: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルエトキシフェニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1744: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシフェニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1761: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1764: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1816: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1900: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1909: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1962: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(6-シクロヘキシルヘキシー-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2089: リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2097: リン酸 モノ 2-アミノ-2

－エチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、及び

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2105：リン酸 モノ 2－アミノ－2－エチル－4－[5－(6－シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、

並びに

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-463：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-479：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-594：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－[5－(4－ベンジルオキシブチル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-760：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－フルオロフェニル)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-761：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－メチルフェニル)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-762：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－エチルフェニル)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-763：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[4－(4－トリフルオロメチルフェニル)ブト－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-764：リン酸 モノ 2－アミノ－2

ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメトキシフェニル)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-765: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーエトキシフェニル)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-766: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメチルチオフェニル)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-832: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(3ーフルオロフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-833: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーフルオロフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-834: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ークロロフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-836: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(3ーメチルフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-837: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーメチルフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-846: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(3ートリフルオロメチルフェニル)ペントー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-847: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ートリフルオロフェニル)ペントー1ーイニ



ル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-848: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-849: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-860: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-メチルチオフエニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-861: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メチルチオフエニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-877: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-878: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジメチルフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1050: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルシクロヘキシルオキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1062: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-フルオロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1063: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1064: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1065: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1066: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1067: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1068: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1134: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1135: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1136: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-クロロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1138: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1139: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1148: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3ートリフルオロメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1149: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ートリフルオロメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1150: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3ーメトキシフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1151: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメトキシフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1162: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3ーメチルチオフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1163: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメチルチオフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1179: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3, 4ージメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1180: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3, 5ージメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1198: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(3ーベンジルオキシプロプー1ーイニル)チオフェン

ー2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1202: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-フルオロフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1203: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1204: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1205: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1206: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メトキシフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1207: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エトキシフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1208: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチオフェニル)メトキシプロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1212: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1266: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1274: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-フルオロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1275: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1276: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-クロロフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1278: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メチルフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1279: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1288: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1289: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1290: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メトキシフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1291: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェニル)メトキシブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1319: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4ージメチルフェニル)メトキシブトー1ー  
イニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1320:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,5ージメチルフェニル)メトキシブトー1ー  
イニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1348:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェ  
ンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1349:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン  
ー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1350:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーエチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン  
ー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1351:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ートリフルオロメチルフェニル)ペンタノイ  
ル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1352:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェ  
ンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1353:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーエトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェ  
ンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1354:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーメチルチオフェニル)ペンタノイル]チオフ  
ェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-1476:リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[4ー(3ーフルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフェ

ン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1477: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1478: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-クロロフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1480: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1481: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1490: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1491: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1492: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メトキシフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1493: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1504: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-メチルチオフェノキシ)ブタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1505: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルチオフエノキシ)ブタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1521: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3,4-ジメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1522: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3,5-ジメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2093: リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフエン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2101: リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフエン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2109: リン酸 モノ 2-アミノ-エチル-4-[5-(6-フェニルヘキサノイル)チオフエン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2257: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジフルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2258: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジフルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2259: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-クロロフェニル)ペント-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2260: リン酸 モノ 2-アミノ-2



ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,4ージクロロフェニル)ペントー1ーイニル]  
チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2261: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,5ージクロロフェニル)ペントー1ーイニル]  
チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2262: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,4ージトリフルオロメチルフェニル)ペント  
ー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2263: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,5ージトリフルオロメチルフェニル)ペント  
ー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2264: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,4ージメトキシフェニル)ペントー1ーイニ  
ル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2265: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,5ージメトキシフェニル)ペントー1ーイニ  
ル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2266: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3,4,5ートリメトキシフェニル)ペントー1ー  
イニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2267: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(3ーアセチルフェニル)ペントー1ーイニル]チ  
オフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2268: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーアセチルフェニル)ペントー1ーイニル]チ  
オフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2269: リン酸 モノ 2ーアミノー2  
ーメチルー4ー{5ー[3ー(3ーフルオロフェノキシ)プロプー1ーイニル]

チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2270: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジフルオロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2271: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジフルオロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2272: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2273: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2274: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジクロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2275: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジクロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2276: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2278: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2279: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2280: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2281: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジトリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2282: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2283: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2284: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2285: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2286: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2287: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2288: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2290: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4ージフルオロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2291:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,5ージフルオロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2292:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3ークロロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2293:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4ージクロロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2294:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,5ージクロロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2295:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4ージトリフルオロメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2296:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,5ージトリフルオロメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2297:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4ージメトキシフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2298:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,5ージメトキシフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-2299:リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(3,4,5ートリメトキシフェノキシ)ブトー1ー

イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2300: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(3-アセチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2301: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-アセチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2328: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2329: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2330: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2331: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2332: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2333: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2334: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフエン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2335: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-メチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2336: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2337: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2338: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2339: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2340: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2341: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3-メトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2342: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,4-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2343: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(3,5-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2344: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー4ー{5ー[5ー(3, 4, 5ートリメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2345: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(3ーアセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル及び

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2346: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[5ー(4ーアセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

であり、最も好適には、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-84: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーフェニルペンチル)フランー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-770: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーシクロヘキシルペントー1ーイニル)フランー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-824: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーフェニルペントー1ーイニル)フランー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1072: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(4ーシクロヘキシルオキシプトー1ーイニル)フランー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-1331: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーシクロヘキシルペンタノイル)フランー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-1 における 5-2278: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[3ー(3, 4ージメチルフェノキシ)プロプー1ーイニル]フランー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-2 における 5-824: リン酸 モノ 2ーアミノー2

ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（５ーフェニルペントー１ーイニル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1063：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー〔３ー（４ーメチル）フェノキシプロプー１ーイニル〕ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1072：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（４ーシクロヘキシルオキシプトー１ーイニル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-2278：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー〔３ー（３，４ージメチルフェノキシ）プロプー１ーイニル〕ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1344：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（５ーフェニルペンタノイル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1331：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（５ーシクロヘキシルペンタノイル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1330：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（４ーフェニルブタノイル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-2における5-1329：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーメチルー５ー（４ーシクロヘキシルブタノイル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-12：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーエチルー５ー（５ーフェニルペンタノイル）ピロールー２ーイル〕ー１ーブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-11：リン酸 モノ ２ーアミノー２ーメチルー４ー〔１ーエチルー５ー（５ーシクロヘキシルペンタノイル）ピロール



ー2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-10:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-4における7-9:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-71:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-98:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-152:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-400:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-463:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-479:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式IIa-3における5-594:リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ー1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-743: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-756: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-770: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-824: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-833: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-849: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1050: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルシクロヘキシルオキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1063: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1064: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1068: リン酸 モノ 2-アミノ-2

ーメチルー4ー{5ー[3ー(4ーメチルチオフェノキシ)プロプー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1072: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(4ーシクロヘキシルオキシブトー1ーイニル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1135: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーフルオロフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1139: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー{5ー[4ー(4ーメチルフェノキシ)ブトー1ーイニル]チオフェンー2ーイル}ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1185: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(3ーシクロヘキシルメトキシプロプー1ーイニル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1266: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(4ーベンジルオキシブトー1ーイニル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1329: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(4ーシクロヘキシルブタノイル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1330: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(4ーフェニルブタノイル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1331: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーシクロヘキシルペンタノイル)チオフェンー2ーイル]ー1ーブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1344: リン酸 モノ 2ーアミノー2ーメチルー4ー[5ー(5ーフェニルペンタノイル)チオフェンー2ーイル]

－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1348：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[5－(4－フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1764：リン酸 モノ 2－アミノ－2－エチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペンチル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-1909：リン酸 モノ 2－アミノ－2－エチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペント－1－イニル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2097：リン酸 モノ 2－アミノ－2－エチル－4－[5－(5－シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン－2－イル]－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2273：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(4－クロロフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2276：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3－メチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2278：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3,4－ジメチルフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2283：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3－メトキシフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2284：リン酸 モノ 2－アミノ－2－メチル－4－{5－[3－(3,4－ジメトキシフェノキシ)プロプ－1－イニル]チオフェン－2－イル}－1－ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2285: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2287: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル及び

例示化合物番号 式 IIa-3 における 5-2288: リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル

である。

上記表 5 [式 (I I, I a-1)、(I I I a-2) 及び (I I I a-3)]、表 6 [(I I I b-1)、(I I I b-2) 及び (I I I b-3)] 並びに表 8 [(I I I a-4)] において、

本発明の化合物 (I I I) として好適には、

例示化合物番号: 5-19, 5-23~5-32, 5-36~5-45, 5-49~5-58, 5-62~5-71, 5-75~5-84, 5-88~5-102, 5-106~5-156, 5-160~5-214, 5-218~5-268, 5-272~5-321, 5-325~5-334, 5-338~5-347, 5-351~5-360, 5-364~5-373, 5-377~5-386, 5-390~5-404, 5-408~5-458, 5-462~5-513, 5-517~5-526, 5-530~5-544, 5-548~5-598, 5-602~5-657, 5-670, 5-674~5-683, 5-696, 5-700~5-717, 5-721~5-730, 5-734~5-743, 5-747~5-756, 5-760~5-774, 5-778~5-828, 5-832~5-886, 5-890~5-940, 5-944~5-993, 5-997~5-1006, 5-1010~5-1019, 5-1045, 5-1049~5-1058, 5-1062~5-1076, 5-1080~5-1130, 5-1134~5-1185, 5-1189~5-1198, 5-1202~5-1208, 5-1212~5-1216, 5-1220~5-1270, 5-1274~5-1331, 5-1335~5-1344, 5-1348~5-1357, 5-1361~5-1370, 5-1374~5-1387, 5-1391~5-1400, 5-1404~5-1418, 5-1422~5-1472, 5-1476~5-1527, 5-1531~5-1540, 5-1544~5-1558, 5-1562~5-1612, 5-1616~5-1673, 5-1677~5-1686, 5-1690~5-1699, 5-1703~5-1712, 5-1716~5-1729, 5-1733~5-1744, 5-1748~5-1768,

5-1772～5-1793, 5-1797～5-1820, 5-1824～5-1846, 5-1850～5-1869, 5-1872,  
5-1876, 5-1880, 5-1884, 5-1888～5-1892, 5-1896, 5-1900, 5-1908～5-1913,  
5-1917～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1970～5-1991, 5-1995～5-2013, 5-2017,  
5- 2021, 5-2025, 5-2029, 5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2046～5-2068,  
5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2113, 5-2117,  
5-2121, 5-2125, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2139～5-2158, 5-2161～5-2164,  
5-2185～5-2346, 5-2398～5-2557,

6-9～6-18, 6-22～6-43, 6-47～6-70, 6-74～6-96, 6-100～6-119, 6-142,  
6-146, 6-150, 6-154, 6-158～6-163, 6-167～6-183, 6-185～6-189, 6-193  
～6-216, 6-220～6-241, 6-245～6-263, 6-267, 6-271, 6-275, 6-279, 6-283,  
6-287～6-292, 6-296～6-318, 6-322～6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-371,  
6-375～6-377, 6-381～6-407, 6-416～6-511,

8-9～8-12

であり、更に好適には、

5-19, 5-32, 5-36～5-45, 5-57, 5-62～5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152  
～5-154, 5-160～5-214, 5-218～5-227, 5-264～5-268, 5-272～5-321, 5-334,  
5-347, 5-360, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458, 5-462～5-513,  
5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598, 5-602～5-653, 5-743, 5-756, 5-760  
～5-768, 5-770～5-774, 5-778～5-828, 5-832～5-886, 5-890～5-940, 5-944  
～5-993, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074, 5-1126～5-1130, 5-1134～  
5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212～5-1214, 5-1266～5-1270, 5-1274  
～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1374～5-1387, 5-1400,  
5-1404～5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556,  
5-1608～5-1612, 5-1616～5-1666, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1759～5-1767,  
5-1789～5-1793, 5-1797～5-1818, 5-1842～5-1846, 5-1900, 5-1908～5-1913,  
5-1935～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1987～5-1991, 5-2013, 5-2017, 5-2029,  
5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2064～5-2068, 5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097,  
5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2185～5-2346, 5-2398

～5-2557,

6-11～6-18, 6-39～6-43, 6-47～6-70, 6-185～6-189, 6-193～6-216, 6-287  
～6-292, 6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-416～6-511,  
8-9～8-12

であり、より好適には、

5-45, 5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-206, 5-209  
～5-212, 5-264～5-266, 5-334, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458,  
5-462～5-485, 5-509, 5-510, 5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598,  
5-602～5-613, 5-649, 5-650, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-772,  
5-824～5-828, 5-832～5-884, 5-936, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074,  
5-1126～5-1130, 5-1134～5-1145, 5-1148～5-1151, 5-1162, 5-1163, 5-1179  
～5-1182, 5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212, 5-1213, 5-1214,  
5-1266～5-1270, 5-1274～5-1285, 5-1288～5-1291, 5-1319～5-1322, 5-1329  
～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1387, 5-1400, 5-1404～  
5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1487, 5-1490～5-1493, 5-1504, 5-1505,  
5-1521～5-1524, 5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616  
～5-1627, 5-1663, 5-1664, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1761～5-1766,  
5-1789～5-1791, 5-1815～5-1818, 5-1900, 5-1909, 5-1962, 5-2064～5-2066,  
5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2105, 5-2133, 5-2216～5-2288, 5-2290～5-2346,  
5-2398～5-2557,

8-9～8-12

であり、更により好適な化合物は、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-84: 3-アミノ-3-メチル-5-  
[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-770: 3-アミノ-3-メチル-5-  
[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチ  
ルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-824: 3-アミノ-3-メチル-5-

[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1063: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1072: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1331: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-2278: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-834: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-クロロフェニル)ペント-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-846: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1065: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-2273: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-2280: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]



フラン-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-2284: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-824: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル] ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1063: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-[3-(4-メチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1072: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-2278: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-84: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1344: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-2332: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-2338: 3-アミノ-3-メチル-5-  
-[1-メチル-5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]ピロール-2-イル} ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-2における5-1331: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-2における5-1330: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-2における5-1329: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-4における8-12: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-4における8-11: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-4における8-10: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-4における8-9: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-3における5-71: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-3における5-84: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式IIIa-3における5-98: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホ

ン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-152: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-210: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-264: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-フェニルヘキシル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-373: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-386: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-フェノキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-400: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-454: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェノキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-509: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-510: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェノキシペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-513: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロピル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1329: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホ

スホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1330: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1331: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1344: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1357: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1370: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(6-フェニルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1387: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルオキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1400: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-フェノキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1414: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1468: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェノキシブタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1523 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルオキシペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1524 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェノキシペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1527 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルメトキシプロパノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1729 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1742 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルエトキシフェニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1744 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシフェニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1761 : 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1764 : 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1816 : 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(6-シクロヘキシルヘキシル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2089 : 3-アミノ-3-エチル-5

－[5－(4－シクロヘキシルブタノイル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2097：3－アミノ－3－エチル－5－[5－(5－シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、及び

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2105：3－アミノ－3－エチル－5－[5－(6－シクロヘキシルヘキサノイル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、

並びに

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-463：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(4－フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-479：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(4－メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-594：3－アミノ－3－メチル－5－[5－(4－ベンジルオキシブチル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1348：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[5－(4－フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1349：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[5－(4－メチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1350：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[5－(4－エチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1351：3－アミノ－3－メチル－5

－{5－[5－(4－トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフエン  
－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1352：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[5－(4－メトキシフェニル)ペンタノイル]チオフエン－2－イル}  
ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1353：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[5－(4－エトキシフェニル)ペンタノイル]チオフエン－2－イル}  
ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1354：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[5－(4－メチルチオフエニル)ペンタノイル]チオフエン－2－イ  
ル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1476：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(3－フルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフエン－2－イル}  
ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1477：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(4－フルオロフェノキシ)ブタノイル]チオフエン－2－イル}  
ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1478：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(4－クロロフェノキシ)ブタノイル]チオフエン－2－イル}ペ  
ンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1480：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(3－メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフエン－2－イル}ペ  
ンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1481：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(4－メチルフェノキシ)ブタノイル]チオフエン－2－イル}ペ  
ンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1490：3－アミノ－3－メチル－5  
－{5－[4－(3－トリフルオロメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフエン

－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1491：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(4－トリフルオロメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1492：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(3－メトキシフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1493：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(4－メトキシフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1504：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(3－メチルチオフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1505：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(4－メチルチオフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1521：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(3,4－ジメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1522：3－アミノ－3－メチル－5－{5－[4－(3,5－ジメチルフェノキシ)ブタノイル]チオフェン－2－イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2093：3－アミノ－3－エチル－5－[5－(4－フェニルブタノイル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2101：3－アミノ－3－エチル－5－[5－(5－フェニルペンタノイル)チオフェン－2－イル]ペンチルホスホン酸、



例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2109 : 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(6-フェニルヘキサノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2328 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2329 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3,4-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2330 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3,5-ジフルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2331 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2332 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2333 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3,4-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2334 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3,5-ジクロロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2335 : 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(3-メチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2336 : 3-アミノ-3-メチル-5

ー{5-[5-(3,4-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2337: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,5-ジメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2338: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2339: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,4-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2340: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2341: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3-メトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2342: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,4-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2343: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,5-ジメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2344: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3,4,5-トリメトキシフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2345: 3-アミノ-3-メチル-5-  
ー{5-[5-(3-アセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}

ペンチルホスホン酸及び

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2346 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[5-(4-アセチルフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

であり、最も好適には、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-84 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-770 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-824 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1072 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-1331 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-1 における 5-2278 : 3-アミノ-3-メチル-5-[5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-824 : 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1063 : 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-[3-(4-メチル)フェノキシプロプ-1-イニル]ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1072: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-2278: 3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1344: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1331: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1330: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-2 における 5-1329: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-4 における 8-12: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-4 における 8-11: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-4 における 8-10: 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-4 における 8-9: 3-アミノ-3-メチル-5-[1

ーエチルー5ー(4ーシクロヘキシルブタノイル)ピロールー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-71: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(4ーシクロヘキシルブチル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-98: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(5ーシクロヘキシルペンチル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-152: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(5ーフェニルペンチル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-400: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(4ーシクロヘキシルオキシブチル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-463: 3ーアミノー3ーメチルー5ー{5ー[4ー(4ーフルオロフェノキシ)ブチル]チオフェンー2ーイル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-479: 3ーアミノー3ーメチルー5ー{5ー[4ー(4ーメトキシフェノキシ)ブチル]チオフェンー2ーイル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-594: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(4ーベンジルオキシブチル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1329: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(4ーシクロヘキシルブタノイル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1330: 3ーアミノー3ーメチルー5ー[5ー(4ーフェニルブタノイル)チオフェンー2ーイル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1331: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1344: 3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1348: 3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-1764: 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

及び

例示化合物番号 式 IIIa-3 における 5-2097: 3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸

である。

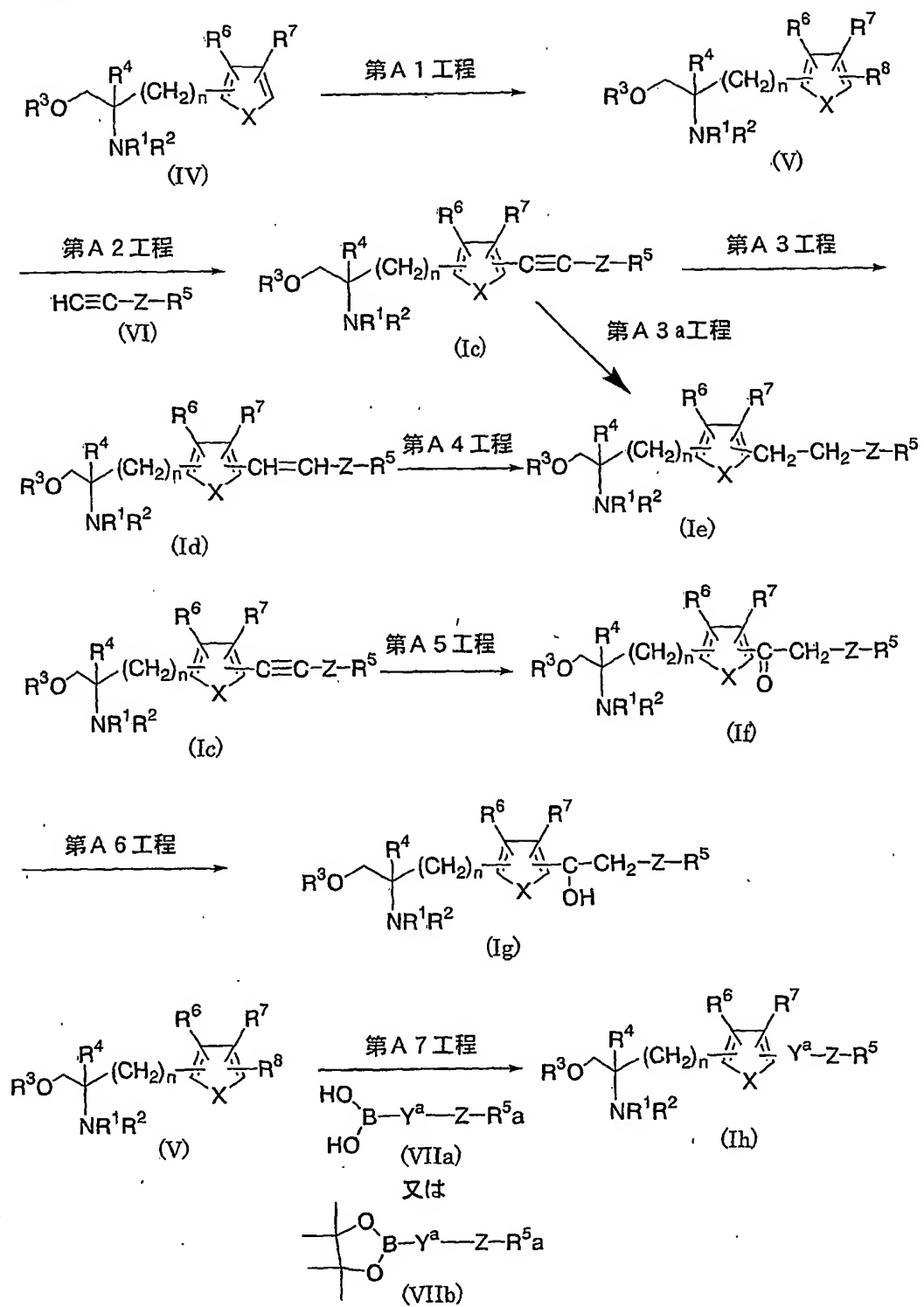
## [発明の実施の形態]

本発明の化合物 (I)、(I I) 及び (I I I) は、以下に記載する方法に従って製造することができる。

## (A 法)

A 法は、化合物 (I) において、Y がエチレン基である化合物 (I c)、Y がビニレン基である化合物 (I d)、Y がエチレン基である化合物 (I e)、Y が  $-CO-CH_2-$  を有する基である化合物 (I f)、Y が  $-CH(OH)-$  を有する基である化合物 (I g) 及び Y がアリール基又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換されたアリール基である化合物 (I h) を製造する方法である。

A法





上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $X$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前述したものと同意義を示し、 $R^8$ は、臭素原子又はヨウ素原子を示し、 $R^5_a$ は、 $R^5$ において置換基として含まれるアミノ、ヒドロキシ及び／又はカルボキシル基が、保護されてもよいアミノ、ヒドロキシ及び／又はカルボキシル基である他 $R^5$ の基の定義における基と同様の基を示し、環 $Y^a$ はアリール基又は置換基群 $a$ から選択される基で1乃至3個置換されたアリール基を示す。

$R^5_a$ の定義における「保護されてもよいアミノ基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるアミノ基の保護基であれば特に限定はされないが、前述したものと同意義を示し、好適には、低級アルコキシカルボニル基であり、最も好適には $t$ -ブトキシカルボニル基である。

$R^5_a$ の定義における「保護されてもよいヒドロキシ基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるヒドロキシ基の保護基であれば特に限定はされないが、例えば、前記「ヒドロキシ基のエステルに斯かる反応における一般的保護基」と同意義を示し、好適には、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、低級アルコキシカルボニル基又は（低級アルコキシ）メチル基であり、更に好適には、低級脂肪族アシル基又は（低級アルコキシ）メチル基であり、最も好適にはアセチル基又はメトキシメチル基である。

$R^5_a$ の定義における「保護されてもよいカルボキシル基」の「保護基」は、有機合成化学の分野で使用されるカルボキシル基の保護基であれば特に限定はされないが、例えば、前記「カルボキシル基のエステルに斯かる反応における一般的保護基」と同意義を示し、好適には低級アルキル基であり、最も好適には、メチル基である。

#### 第A1工程

第A1工程は、一般式(V)を有する化合物を製造する工程であり、一般式(IV)を有する化合物を、不活性溶媒中、塩基の存在下又は非存在下、臭素化剤又はヨウ素化剤と反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれ

ば特に限定されず、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；又はホルムアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類であり、好適には、臭素化の場合にはアミド類（最も好適にはN，N-ジメチルホルムアミド）であり、ヨウ素化の場合にはハロゲン化炭化水素類（最も好適にはジクロロメタン又はクロロホルム）である。

上記反応に使用される臭素化剤としては、特に限定はないが、例えば、“Comprehensive Organic Transformation” (Larlock, VCH, p316-317) に記載されているような臭素化剤を挙げることができ、好適には、N-ブロムコハク酸イミドである。

上記反応に使用されるヨウ素化剤としては、特に限定はないが、例えば、“Comprehensive Organic Transformation” (Larlock, VCH, p317-318) に記載されているようなヨウ素化剤を挙げることができ、好適には、ヨウ素である。

上記反応に使用される塩基としては、化合物 (I V) におけるハロゲン原子の置換位置以外の部分に影響を与えないものであれば特に限定されず、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩類；リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシドのような金属アルコキシド類；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、2，6-ルチジン、4-(N，N-ジメチルアミノ)ピリジン、N，N-ジメチルアニリン、N，N-ジエチルアニリン、1，5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノナ-5-エン、1，4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン (DABCO)、1，8-ジアザビシクロ

[5. 4. 0]—7—ウンデセン (DBU) のような有機アミン類；ブチルリチウム、リチウム ジイソプロピルアミド (LDA)、リチウム ビス (トリメチルシリル) アミドのような有機金属塩基類；又は上記塩基の組み合わせを挙げることができる。好適には、有機アミン類 (最も好適にはピリジン) である。

反応温度は、原料化合物、臭素化剤又はヨウ素化剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $150^{\circ}\text{C}$  で行われるが、好適には  $-20^{\circ}\text{C}$  乃至  $100^{\circ}\text{C}$  (最も好適には  $0^{\circ}\text{C}$  乃至  $60^{\circ}\text{C}$ ) である。

反応時間は、反応温度、原料化合物、反応試薬又は使用される溶媒の種類によって異なるが、通常、5 分間乃至 60 時間であり、好適には 15 分乃至 24 時間 (最も好適には 30 分間乃至 4 時間) である。

反応終了後、本反応及び後述する第 A 2 工程乃至第 A 7 工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又は通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム—シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックス LH—20 (ファルマシア社製)、アンバーライト XAD—11 (ローム・アンド・ハース社製)、ダイヤイオン HP—20 (三菱化学社製) のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又は、シリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法 (好適には、高速液体クロマトグラフィーである。) を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

## 第A2工程

第A2工程は、一般式(Ic)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(V)を、不活性溶媒中、窒素雰囲気下、塩基及びパラジウム触媒の存在下、化合物(VI)とSonogashira coupling反応させ、所望によりヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシ基の保護基を除去することにより行なわれる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ギ酸エチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロヘキサノンのようなケトン類；アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類；ホルムアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；又はスルホランのようなスルホン類；であり、好適には、エーテル類、アミド類又はスルホキシド類（最も好適には、エーテル類又はアミド類）である。また、反応溶媒中に少量の水を添加することで、反応の進行が促進されることがある。

上記反応に使用される塩基としては、通常Sonogashira coupling反応に使用される塩基であれば特に限定はないが、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩類；水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金

属水素化物類；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；又はトリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノナ-5-エン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)のような有機アミン類；であり、好適には有機アミン類（最も好適にはトリエチルアミン）である。

上記反応に使用されるパラジウム触媒としては、通常Sonogashira coupling反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、炭酸パラジウムのようなパラジウム塩類、配位子と錯体を形成しているジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム錯体のようなパラジウム塩錯体類、パラジウム-炭素等を挙げることができる。

また、添加剤として、ヨウ化銅(I)、塩化ベンジルトリエチルアンモニウムを使用することにより、収率を向上させることができる。

反応温度は、原料化合物、塩基、溶媒の種類等によって異なるが、通常、-20℃乃至200℃（好適には0℃乃至120℃）である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分乃至48時間（好適には15分乃至24時間）である。

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>におけるヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシ基の保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

本工程の目的化合物(Ic)は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている各種クロマトグラフィー法を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製する

ことができる。

### 第A3工程

第A3工程は、一般式(I d)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物(I c)を還元(好適には、水素雰囲気下、接触還元)して、所望によりヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシル基の保護基を除去することにより行われる。該保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

上記反応における接触還元を使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；酢酸、塩酸のような有機酸類；水；又は上記溶媒と水との混合溶媒；であり、好適には、エーテル類又はアルコール類(最も好適には、メタノール)である。

接触還元を使用される触媒としては、通常、三重結合を二重結合に還元する反応に使用されるものであれば、特に限定はないが、好適には、パラジウム-炭酸カルシウム、パラジウム-酸化アルミニウム、パラジウム-炭素、パラジウム-硫酸バリウムのようなパラジウム類又はロジウム-酸化アルミニウムのようなロジウム類であり、より好適にはパラジウム-炭酸カルシウ

ムである。

なお、本工程で、化合物（I c）の側鎖に含まれるエチニレン基を、ビニレン基に還元し、エチレン基にまで還元しないために、反応溶媒中に、ピリジン、キノリンのような塩基性芳香族化合物、アンモニア、トリエチルアミンのようなアミン類（好適には、キノリン）を添加して、触媒を不活性化してもよい。

水素圧は特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われ、好適には1気圧である。

反応温度は、原料化合物、触媒、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ （好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分乃至96時間（好適には15分乃至72時間）である。

本工程の目的化合物（I d）は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿又は通常、有機化合物の分離精製に慣用されている各種クロマトグラフィー法を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

#### 第A4工程

第A4工程は、一般式（I e）を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物（I d）を還元（好適には、水素雰囲気下、接触還元）して、所望によりヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシル基の保護基を除去することにより行われる。該保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

上記反応における接触還元を使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、上記第A3工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、エステル類、エーテル類又はアルコール類（最も好適には、酢酸エチル又はメタノール）である。

上記反応における接触還元を使用される触媒としては、通常、接触還元反応に使用されるものであれば、特に限定はなく、例えば、パラジウム－炭素、パラジウム黒、水酸化パラジウム、パラジウム－硫酸バリウムのようなパラジウム類、酸化白金、白金黒のような白金類、ロジウム－酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン－塩化ロジウムのようなロジウム類、ラネーニッケルのようなニッケル類を挙げることができる。

水素圧は特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われ、好適には1気圧である。

反応温度は、原料化合物、触媒、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ （好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分乃至96時間（好適には15分乃至72時間）である。

本工程の目的化合物（I e）は、必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿又は通常、有機化合物の分離精製に慣用されている各種クロマトグラフィー法を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

### 第A3a工程

なお、一般式（I e）を有する化合物を、不活性溶媒中、化合物（I c）を還元（好適には、水素雰囲気下、接触還元）して、所望によりヒドロキシ基、アミノ基及び／またはカルボキシル基の保護基を除去することにより、2工程を経ずに一段で製造することもでき、この場合は、接触還元を使用される不活性溶媒及び接触還元を使用される触媒は、通常、接触還元反応に使用されるものであれば、特に限定はなく、上記第A4工程において使用されるものと同様のものを挙げることができる。

水素圧は特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われ、好適には1気圧である。

反応温度は、原料化合物、触媒、溶媒の種類等によって異なるが、通常、



-20℃乃至200℃（好適には0℃乃至100℃）である。

反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分乃至96時間（好適には15分乃至72時間）である。

#### 第A5工程

第A5工程は、一般式（I f）を有する化合物を製造する工程であり、化合物（I c）を、不活性溶媒中、酸触媒を用いた水の付加反応を行い、所望により、ヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシル基の保護基を除去することにより行われる。該保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；蟻酸エチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロヘキサノンのようなケトン類；水；又は上記溶媒の混合溶媒；であり、好適には、アルコール類である。

上記反応に使用される酸触媒としては、通常の反応において酸触媒として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸のような無機酸又は酢酸、ギ酸、シュウ酸、メタンス

ルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸等のブレンステッド酸或いは塩化亜鉛、四塩化スズ、ボロントリクロリド、ボロントリフルオリド、ボロントリブロミドのようなルイス酸又は、酸性イオン交換樹脂を挙げることができ、好適には無機酸である。

反応温度は、原料化合物、触媒、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ （好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5分乃至96時間（好適には15分乃至72時間）である。

#### 第A6工程

第A6工程は、一般式(Ig)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物(I f)のCO基を $-\text{CH}(\text{OH})-$ 基に還元して、所望により、ヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシ基の保護基を除去することにより行われる。該保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、本反応に不活性なものであれば特に限定はされないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；又はメタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類或は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、エーテル類又はアルコール類（最も好適には、メタノール又はエタノール）である。

上記反応に使用される還元剤としては、CO基を $-CH(OH)-$ 基に還元できる還元剤であれば特に限定はされないが、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化シアノホウ素ナトリウムのような水素化ホウ素アルカリ金属類；又は水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化アルミニウムリチウム、水素化トリエトキシアルミニウムリチウムのような水素化アルミニウム化合物；であり、好適には水素化ホウ素アルカリ金属類（特に、水素化ホウ素ナトリウム）である。

反応温度は、原料化合物、還元剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-10^{\circ}C$ 乃至 $100^{\circ}C$ （好適には $-20^{\circ}C$ 乃至 $20^{\circ}C$ ）である。

反応時間は、原料化合物、還元剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分間乃至48時間（好適には30分間乃至12時間）である。

#### 第A7工程

第A7工程は、一般式(Ih)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(V)を化合物(VIIa)又は(VIIb)とSuzuki coupling反応させた後、所望によりヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシ基の保護基を除去することにより行われる。該保護基の除去は、後述する第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $0^{\circ}C$ 乃至 $150^{\circ}C$ （好適には $10^{\circ}C$ 乃至 $100^{\circ}C$ ）である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至24時間（好適には30分乃至12時間）である。

上記反応に使用される溶媒、塩基及びパラジウム触媒としては、前述の第A2工程のSonogashira Coupling反応で用いられるものと同様なものを挙げることができる。

本工程の目的化合物(Ih)は必要ならば、常法、例えば、再結晶、再沈殿又は通常、有機化合物の分離精製に慣用されている各種クロマトグラフィー法を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製するこ

とができる。

所望の工程である、ヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシ基の保護基の除去はその種類によって異なるが、一般に有機合成化学の技術において周知の方法、例えば、T.W.Green, (Protective Groups in Organic Synthesis), John Wiley & Sons; J.F.W.McOmis, (Protective Groups in Organic Chemistry), Plenum Press に記載の方法により行うことができ、例えば、以下のように行うことができる。

アミノ基の保護基が、シリル類である場合には、通常、フッ化テトラブチルアンモニウム、フッ化水素酸、フッ化水素酸－ピリジン、フッ化カリウムのようなフッ素アニオンを生成する化合物で処理することにより除去される。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類が好適である。

反応温度及び反応時間は、特に限定はないが、通常、0℃乃至50℃で10分間乃至18時間実施される。

アミノ基の保護基が、脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシッフ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合には、水性溶媒の存在下に、酸又は塩基で処理することにより除去することができる。

上記反応に使用される酸としては、通常酸として使用されるもので反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、臭化水素酸、塩酸、硫酸、過塩素酸、リン酸、硝酸のような無機酸であり、好適には塩酸である。

上記反応に使用される塩基としては、通常塩基として使用されるもので反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、好適には、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；

リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシドのような金属アルコキシド類；アンモニア水、濃アンモニア-メタノールのようなアンモニア類であり、より好適には、アルカリ金属水酸化物である。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、通常の加水分解反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルプのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；水；水と上記有機溶媒との混合溶媒；であり、好適にはエーテル類又はアルコール類と水との混合溶媒（最も好適にはテトラヒドロフラン、ジオキサン、エタノール、メタノールと水との混合溶媒）である。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、溶媒及び使用される酸若しくは塩基等により異なり、特に限定はないが、副反応を抑制するために、通常、0℃乃至150℃で、1時間乃至10時間反応させる。

アミノ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合には、通常、不活性溶媒中、還元剤と接触させること（好適には、触媒下、常温にて接触還元）により除去する方法又は酸化剤を用いて除去する方法が好適である。

接触還元による除去に使用される不活性溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノ

ール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；酢酸のような有機酸類；水；上記溶媒と水との混合溶媒；であり、好適には、アルコール類、エーテル類、有機酸類又は水（最も好適には、アルコール類又は有機酸類）である。

接触還元による除去に使用される触媒としては、通常、接触還元反応に使用されるものであれば、特に限定はないが、好適には、パラジウム-炭素、ラネーニッケル、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム、パラジウム-硫酸バリウムが用いられる。

水素の圧力は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行なわれる。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、0℃乃至100℃で、5分間乃至24時間実施される。

酸化剤を用いる除去において使用される不活性溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトンのようなケトン類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；及びジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類；スルホラン；であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類、エーテル類又はスルホキシド類（最も好適には、ハロゲン化炭化水素類又はスルホキシド類）である。

使用される酸化剤としては、通常酸化剤として使用されるもので反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、好適には、過硫酸カリウム、過硫酸ナトリウム、アンモニウムセリウムナイトレート（CAN）、2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-p-ベンゾキノン（DDQ）が用いられる。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、0℃乃至150℃で、10分間乃至24時間実施される。

また、アミノ基の保護基が、アラルキル類である場合には、不活性溶媒中、酸を用いて保護基を除去することもできる。

上記反応に使用される酸は、通常の反応において酸触媒として使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸のような無機酸；酢酸、ギ酸、シュウ酸、メタンスルホン酸、p-ートルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸等のブレンステッド酸；塩化亜鉛、四塩化スズ、ボロントリクロリド、ボロントリフルオリド、ボロントリブロミドのようなルイス酸；酸性イオン交換樹脂；であり、好適には、無機酸又は有機酸（最も好適には、塩酸、酢酸又はトリフルオロ酢酸）である。

上記反応に使用される不活性溶媒は、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；或は水又は上記溶媒の混合溶媒；であり、好適には、エーテル類、アルコール類又は水（最も好適には、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エタノール又は水）である。

反応温度は、原料化合物、使用される酸、溶媒等により異なるが、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至沸点温度（好適には、 $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、原料化合物、使用される酸、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分間乃至48時間（好適には、30分間乃至20時間）である。

アミノ基の保護基がアルケニルオキシカルボニル類である場合は、通常、アミノの保護基が前記の脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシッフ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合の除去反応の条件と同様にして、塩基と処理することにより行われる。

尚、アミノ基の保護基がアリルオキシカルボニル基の場合は、特に、パラジウム、及びトリフェニルホスフィン若しくはニッケルテトラカルボニルを使用して保護基を除去する方法が簡便で、副反応が少なく実施することができる。

ヒドロキシ基の保護基として、シリル類を使用した場合には、通常、フッ化テトラブチルアンモニウム、フッ化水素酸、フッ化水素酸-ピリジン、フッ化カリウムのようなフッ素アニオンを生成する化合物で処理するか、又は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、リン酸のような無機酸又は酢酸、ギ酸、シュウ酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸（好適には、塩酸）で処理することにより除去できる。

フッ素アニオンにより保護基を除去する場合に使用される不活性溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、好適には、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類；酢酸のような有機酸；水；上記溶媒の混合溶媒であり、より好適には、テトラヒドロフランである。

尚、フッ素アニオンにより保護基を除去する場合に、ギ酸、酢酸、プロピ



オン酸のような有機酸を加えることによって、反応を促進させたり、反応生成物の分解を防いで、収率を向上させることができる。

フッ素アニオンにより保護基を除去する場合の反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には、10℃乃至50℃）で、1時間乃至24時間実施される。

無機酸又は有機酸により保護基を除去する場合、アミノ基又はイミノ基の保護基がアラルキル類である場合の除去反応の条件と同様にして、無機酸又は有機酸と処理することにより達成される。

ヒドロキシ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合には、通常、不活性溶媒中、還元剤と接触させることにより（好適には、触媒下、常温にて接触還元）除去する方法又は酸化剤を用いて除去する方法が好適である。

接触還元による除去に使用される不活性溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、アミノ基又はイミノ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合、還元剤と接触させることにより除去する際に使用される不活性溶媒と同様なものを挙げることができ、好適にはアルコール類（最も好適にはメタノール）である。

接触還元による除去に使用される触媒としては、通常、接触還元反応に使用されるものであれば、特に限定はないが、例えば、アミノ基又はイミノ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合、還元剤と接触させることにより除去する際に使用される不活性触媒と同様なものを挙げることができ、好適にはパラジウム-炭素である。

圧力は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行なわれる。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には、20℃乃至70℃）、5分間乃至48時間（好適には、1時間乃至24時間）である。

酸化剤を用いる除去において使用される溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、アミノ基の保護基が、アラルキル

類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合、酸化剤と接触させることにより除去する際に使用される不活性溶媒と同様なものを挙げることができる。

使用される酸化剤としては、酸化に使用される化合物であれば特に限定はないが、例えば、アミノ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合、酸化剤と接触させることにより除去する際に使用される酸化剤と同様なものを挙げることができる。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、触媒、溶媒等により異なるが、通常、0℃乃至150℃で、10分間乃至24時間実施される。

また、液体アンモニア中若しくはメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類中において、-78℃乃至0℃で、金属リチウム、金属ナトリウムのようなアルカリ金属類を作用させることによっても除去できる。

更に、ヒドロキシ基の保護基が、アラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル類である場合には、溶媒中、塩化アルミニウム-ヨウ化ナトリウム又は、ヨウ化トリメチルシランのようなアルキルシリルハライド類を用いることにより、保護基を除去することができる。

塩化アルミニウム-ヨウ化ナトリウム又はアルキルシリルハライド類を用いて保護基を除去する場合使用される不活性溶媒としては、本反応に関与しないものであれば特に限定はないが、好適には、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；アセトニトリルのようなニトリル類；上記溶媒の混合溶媒；が挙げられる。

塩化アルミニウム-ヨウ化ナトリウム又はアルキルシリルハライド類を用いて保護基を除去する場合の反応温度及び反応時間は、原料化合物、溶媒等により異なるが、通常は0℃乃至50℃で、5分間乃至72時間実施される。

尚、反応基質が硫黄原子を有する場合は、好適には、塩化アルミニウム-

ヨウ化ナトリウムが用いられる。

ヒドロキシ基の保護基が、脂肪族アシル類、芳香族アシル類又はアルコキシカルボニル基類である場合には、溶媒中、塩基で処理することにより除去される。

上記反応において使用される塩基としては、通常塩基として使用されるもので化合物の他の部分に影響を与えないものであれば特に限定はないが、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属重炭酸塩類；水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；リチウムメトキシド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシドのような金属アルコキシド類；アンモニア水、濃アンモニア-メタノールのようなアンモニア類；であり、好適には、アルカリ金属水酸化物類、金属アルコキシド類又はアンモニア類（最も好適には、アルカリ金属水酸化物類又は金属アルコキシド類）である。

上記反応において使用される溶媒としては、通常の加水分解反応に使用されるものであれば特に限定はないが、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；水；上記溶媒の混合溶媒が好適である。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、使用される塩基、溶媒等により異なり特に限定はないが、副反応を抑制するために、通常、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $150^{\circ}\text{C}$ で、1時間乃至10時間実施される。

ヒドロキシ基の保護基が、アルコキシメチル類、テトラヒドロピラニル類、テトラヒドロチオピラニル類、テトラヒドロフラニル類、テトラヒドロチオ

フラニル類又は置換されたエチル類である場合には、通常、不活性溶媒中、酸で処理することにより除去される。

上記反応に使用される酸としては、通常、ブレンステッド酸又はルイス酸として使用されるものであれば特に限定はなく、好適には、塩化水素；塩酸、硫酸、硝酸のような無機酸；又は酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸のような有機酸等のブレンステッド酸；三フッ化ホウ素のようなルイス酸であり、より好適には、塩酸又は酢酸であり、また、ダウエックス50Wのような強酸性の陽イオン交換樹脂も使用することができる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、反応を阻害しないものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ギ酸エチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、イソホロン、シクロヘキサノンのようなケトン類；水；上記溶媒の混合溶媒；であり、好適には、エーテル類（最も好適には、テトラヒドロフラン）又はアルコール類（最も好適には、メタノール）である。

反応温度及び反応時間は、原料化合物、使用される酸、溶媒等により異なるが、通常、-10℃乃至200℃（好適には、0℃乃至150℃）で、5分間乃至48時間（好適には、30分間乃至10時間）である。

ヒドロキシ基の保護基が、アルケニルオキシカルボニル類である場合は、通常、ヒドロキシ基の保護基が前記の脂肪族アシル類、芳香族アシル類又はアルコキシカルボニル類である場合の除去反応の条件と同様にして、塩基と処理することにより達成される。

尚、アリルオキシカルボニル基の場合は、特にパラジウム、及びトリフェニルホスフィン、又はビス（メチルジフェニルホスフィン）（1，5－シクロオクタジエン）イリジウム（I）・ヘキサフルオロホスフェートを使用して除去する方法が簡便で、副反応が少なく実施することができる。

カルボキシ基の保護基が、低級アルキル基又は低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ハロゲン若しくはシアノで置換されてもよい1乃至3個のアリールで置換された低級アルキル基である場合は、通常、ヒドロキシ基の保護基が前記の脂肪族アシル類、芳香族アシル類又はアルコキシカルボニル類である場合の除去反応の条件と同様にして、塩基と処理することにより達成される。

また、アミノ、ヒドロキシ及び／又はカルボキシ基の保護基の除去は、順不同で希望する除去反応を順時実施することができる。

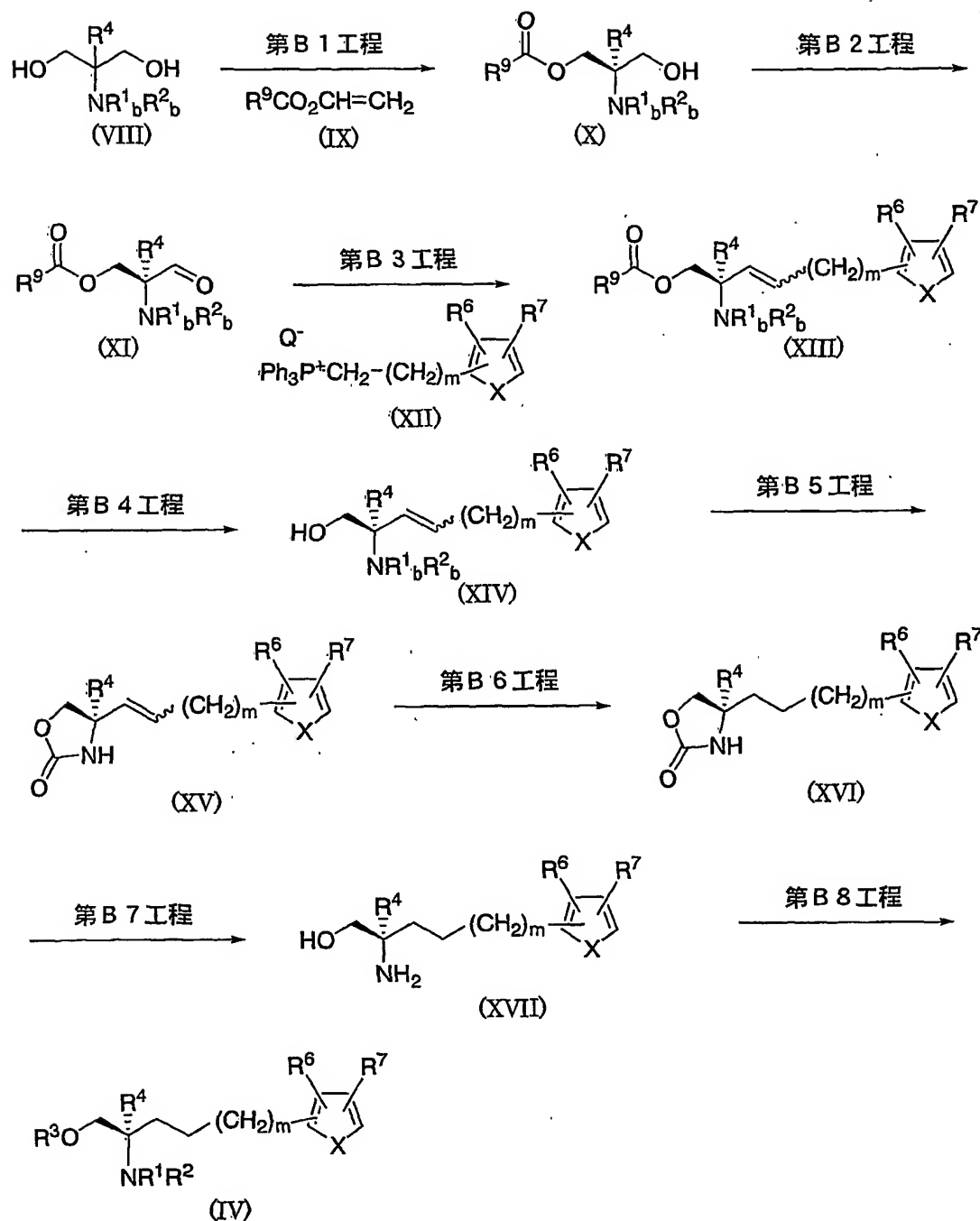
尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

原料化合物（VI）及び（VII）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法に従って容易に製造される。

#### （B法）

B法は、本発明の化合物（I）の中間体である化合物（IV）を製造する方法である。

B法



上記式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{R}^7$ 及び $\text{X}$ は、前述したものと同意義を示し、式 $-\text{NR}^1_b\text{R}^2_b$ を有する基は、カルボニル基を有する保護基で保護されたアミノ基を示し、 $\text{R}^9$ は、 $\text{C}_1-\text{C}_{20}$ アルキル基、ヘテロ原子が介

在する  $C_2-C_{20}$  アルキル基、アリール基又は芳香族複素環基で置換された  $C_1-C_{20}$  アルキル基、 $C_2-C_{20}$  アルキニル基、ヘテロ原子が介在する  $C_3-C_{20}$  アルキニル基、アリール基又は芳香族複素環基で置換された  $C_2-C_{20}$  アルキニル基、 $C_2-C_{20}$  アルケニル基、ヘテロ原子が介在する  $C_3-C_{20}$  アルケニル基、アリール基又は芳香族複素環基で置換された  $C_2-C_{20}$  アルケニル基、アリール基又は芳香族複素環基で置換されたヘテロ原子が介在する  $C_2-C_{20}$  アルキル基、或は  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基を示し、 $m$  は 0 乃至 4 の整数を示し、 $Ph$  はフェニル基を示し、 $Q$  はハロゲン原子（好適には、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子）を示す。

上記において、 $R^9$  の定義における「 $C_1-C_{20}$  アルキル基」は、例えば、前記「低級アルキル基」、ヘプチル、1-メチルヘキシル、2-メチルヘキシル、3-メチルヘキシル、4-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、1-プロピルブチル、4, 4-ジメチルペンチル、オクチル、1-メチルヘプチル、2-メチルヘプチル、3-メチルヘプチル、4-メチルヘプチル、5-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル、1-プロピルペンチル、2-エチルヘキシル、5, 5-ジメチルヘキシル、ノニル、3-メチルオクチル、4-メチルオクチル、5-メチルオクチル、6-メチルオクチル、1-プロピルヘキシル、2-エチルヘプチル、6, 6-ジメチルヘプチル、デシル、1-メチルノニル、3-メチルノニル、8-メチルノニル、3-エチルオクチル、3, 7-ジメチルオクチル、7, 7-ジメチルオクチル、ウンデシル、4, 8-ジメチルノニル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、3, 7, 11-トリメチルドデシル、ヘキサデシル、4, 8, 12-トリメチルトリデシル、1-メチルペンタデシル、14-メチルペンタデシル、13, 13-ジメチルテトラデシル、ヘプタデシル、15-メチルヘキサデシル、オクタデシル、1-メチルヘプタデシル、ノナデシル、アイコシル、及び、3, 7, 11, 15-テトラメチルヘキサデシル基のような炭素数 1 乃至 20 個の直鎖又は分枝鎖アルキル基であり、好適には  $C_1-C_{10}$  アルキル基である。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「ヘテロ原子が介在するC<sub>2</sub>—C<sub>20</sub>アルキル基」は、前記「C<sub>1</sub>—C<sub>20</sub>アルキル基」の内の「炭素数2乃至20個のアルキル基」が、同一又は異なって、1又は2個の、硫黄原子、酸素原子、又は、窒素原子で介在されている基を示し、例えば、メチルチオメチル、1-メチルチオエチル、2-メチルチオエチル、エチルチオメチル、1-メチルチオプロピル、2-メチルチオプロピル、3-メチルチオプロピル、2-エチルチオエチル、2-メチル-2-メチルチオエチル、1-メチルチオブチル、2-メチルチオブチル、3-メチルチオブチル、2-エチルチオプロピル、3-メチル-3-メチルチオプロピル、4-メチルチオペンチル、3-メチルチオペンチル、2-メチルチオペンチル、1-メチルチオペンチル、3, 3-ジメチルチオブチル、2, 2-ジメチルチオブチル、1, 1-ジメチルチオブチル、1-メチル-2-メチルチオブチル、1, 3-ジメチルチオブチル、2, 3-ジメチルチオブチル、2-エチルチオブチル、1-メチルチオヘキシル、2-メチルチオヘキシル、3-メチルチオヘキシル、4-メチルチオヘキシル、5-メチルチオヘキシル、1-プロピルチオブチル、4-メチル-4-メチルチオペンチル、1-メチルチオヘプチル、2-メチルチオヘプチル、3-メチルチオヘプチル、4-メチルチオヘプチル、5-メチルチオヘプチル、6-メチルチオヘプチル、1-プロピルチオペンチル、2-エチルチオヘキシル、5-メチル-5-メチルチオヘキシル、3-メチルチオオクチル、4-メチルチオオクチル、5-メチルチオオクチル、6-メチルチオオクチル、1-プロピルチオヘキシル、2-エチルチオヘプチル、6-メチル-6-メチルチオヘプチル、1-メチルチオノニル、3-メチルチオノニル、8-メチルチオノニル、3-エチルチオオクチル、3-メチル-7-メチルチオオクチル、7, 7-ジメチルチオオクチル、4-メチル-8-メチルチオノニル、3, 7-ジメチル-11-メチルチオドデシル、4, 8-ジメチル-12-メチルチオトリデシル、1-メチルチオペンタデシル、14-メチルチオペンタデシル、13-メチル-13-メチルチオテトラデシル、15-メチルチオヘキサデシル、1-メチルチオヘプタデシ



ル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルチオヘキサデシルのような1又は2個の硫黄原子で介在されている炭素数2乃至20個のアルキル基;メチルオキシメチル、1-メチルオキシエチル、2-メチルオキシエチル、エチルオキシメチル、1-メチルオキシプロピル、2-メチルオキシプロピル、3-メチルオキシプロピル、2-エチルオキシエチル、2-メチル-2-メチルオキシエチル、1-メチルオキシブチル、2-メチルオキシブチル、3-メチルオキシブチル、2-エチルオキシプロピル、3-メチル-3-メチルオキシプロピル、4-メチルオキシペンチル、3-メチルオキシペンチル、2-メチルオキシペンチル、1-メチルオキシペンチル、3, 3-ジメチルオキシブチル、2, 2-ジメチルオキシブチル、1, 1-ジメチルオキシブチル、1-メチル-2-メチルオキシブチル、1, 3-ジメチルオキシブチル、2, 3-ジメチルオキシブチル、2-エチルオキシブチル、1-メチルオキシヘキシル、2-メチルオキシヘキシル、3-メチルオキシヘキシル、4-メチルオキシヘキシル、5-メチルオキシヘキシル、1-プロピルオキシブチル、4-メチル-4-メチルオキシペンチル、1-メチルオキシヘプチル、2-メチルオキシヘプチル、3-メチルオキシヘプチル、4-メチルオキシヘプチル、5-メチルオキシヘプチル、6-メチルオキシヘプチル、1-プロピルオキシペンチル、2-エチルオキシヘキシル、5-メチル-5-メチルオキシヘキシル、3-メチルオキシオクチル、4-メチルオキシオクチル、5-メチルオキシオクチル、6-メチルオキシオクチル、1-プロピルオキシヘキシル、2-エチルオキシヘプチル、6-メチル-6-メチルオキシヘプチル、1-メチルオキシノニル、3-メチルオキシノニル、8-メチルオキシノニル、3-エチルオキシオクチル、3-メチル-7-メチルオキシオクチル、7, 7-ジメチルオキシオクチル、4-メチル-8-メチルオキシノニル、3, 7-ジメチル-11-メチルオキシドデシル、4, 8-ジメチル-12-メチルオキシトリデシル、1-メチルオキシペンタデシル、14-メチルオキシペンタデシル、13-メチル-13-メチルオキシテトラデシル、15-メチルオキシヘキサデシル、1-メチルオ

キシヘプタデシル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルオキシヘキサデシルのような1又は2個の酸素原子で介在されている炭素数2乃至20個のアルキル基；N-メチルアミノメチル、1-(N-メチルアミノ)エチル、2-(N-メチルアミノ)エチル、N-エチルアミノメチル、1-(N-メチルアミノ)プロピル、2-(N-メチルアミノ)プロピル、3-(N-メチルアミノ)プロピル、2-(N-エチルアミノ)エチル、2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル、1-(N-メチルアミノ)ブチル、2-(N-メチルアミノ)ブチル、3-(N-メチルアミノ)ブチル、2-(N-エチルアミノ)プロピル、3-(N, N-ジメチルアミノ)プロピル、4-(N-メチルアミノ)ペンチル、3-(N-メチルアミノ)ペンチル、2-(N-メチルアミノ)ペンチル、1-(N-メチルアミノ)ペンチル、3-(N, N-ジメチルアミノ)ブチル、2-(N, N-ジメチルアミノ)ブチル、1-(N, N-ジメチルアミノ)ブチル、1-メチル-2-(N-メチルアミノ)ブチル、1, 3-ジ(N-メチルアミノ)ブチル、2, 3-ジ(N-メチルアミノ)ブチル、2-(N-エチルアミノ)ブチル、1-(N-メチルアミノ)ヘキシル、2-(N-メチルアミノ)ヘキシル、3-(N-メチルアミノ)ヘキシル、4-(N-メチルアミノ)ヘキシル、5-(N-メチルアミノ)ヘキシル、1-(N-プロピルアミノ)ブチル、4-メチル-4-(N-メチルアミノ)ペンチル、1-(N-メチルアミノ)ヘプチル、2-(N-メチルアミノ)ヘプチル、3-(N-メチルアミノ)ヘプチル、4-(N-メチルアミノ)ヘプチル、5-(N-メチルアミノ)ヘプチル、6-(N-メチルアミノ)ヘプチル、1-(N-プロピルアミノ)ペンチル、2-(N-エチルアミノ)ヘキシル、5-メチル-5-(N-メチルアミノ)ヘキシル、3-(N-メチルアミノ)オクチル、4-(N-メチルアミノ)オクチル、5-(N-メチルアミノ)オクチル、6-(N-メチルアミノ)オクチル、1-(N-プロピルアミノ)ヘキシル、2-(N-エチルアミノ)ヘプチル、6-メチル-6-(N-メチルアミノ)ヘプチル、1-(N-メチルアミノ)ノニル、3-(N-メチルアミノ)ノニル、8-(

N-メチルアミノ)ノニル、3-(N-エチルアミノ)オクチル、3-メチル-7-(N-メチルアミノ)オクチル、7,7-ジ(N-メチルアミノ)オクチル、4-メチル-8-(N-メチルアミノ)ノニル、3,7-ジメチル-11-(N-メチルアミノ)ドデシル、4,8-ジメチル-12-(N-メチルアミノ)トリデシル、1-(N-メチルアミノ)ペンタデシル、14-(N-メチルアミノ)ペンタデシル、13-メチル-13-(N-メチルアミノ)テトラデシル、15-(N-メチルアミノ)ヘキサデシル、1-(N-メチルアミノ)ヘプタデシル、及び、3,7,11-トリメチル-15-(N-メチルアミノ)ヘキサデシルのような1又は2個の窒素原子で介在されている炭素数2乃至20個のアルキル基を挙げることができ、好適には、ヘテロ原子が介在するC<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>アルキル基である。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「アリール基又は芳香族複素環基で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>アルキル基」は、前記「炭素数C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>アルキル基」が、同一又は異なって、1又は3個のアリール基又は芳香族複素環基で置換された基を示し、斯かる「アリール基」及び「芳香族複素環基」は、前述したものと同意義を示す。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>アルキニル基」は、例えば、エチニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-2-プロピニル、2-エチル-2-プロピニル、2-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-2-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-ペンチニル、1-メチル-2-ペンチニル、2-メチル-2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、ヘプチニル、1-メチルヘキシニル、2-メチルヘキシニル、3-メチルヘキシニル、4-メチルヘキシニル、5-メチルヘキシニル、1-プロピルブチニル、4,4-ジメチルペンチニル、オ

クチニル、1-メチルヘプチニル、2-メチルヘプチニル、3-メチルヘプチニル、4-メチルヘプチニル、5-メチルヘプチニル、6-メチルヘプチニル、1-プロピルペンチニル、2-エチルヘキシニル、5, 5-ジメチルヘキシニル、ノニニル、3-メチルオクチニル、4-メチルオクチニル、5-メチルオクチニル、6-メチルオクチニル、1-プロピルヘキシニル、2-エチルヘプチニル、6, 6-ジメチルヘプチニル、デシニル、1-メチルノニニル、3-メチルノニニル、8-メチルノニニル、3-エチルオクチニル、3, 7-ジメチルオクチニル、7, 7-ジメチルオクチニル、ウンデシニル、4, 8-ジメチルノニニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、3, 7, 11-トリメチルドデシニル、ヘキサデシニル、4, 8, 12-トリメチルトリデシニル、1-メチルペンタデシニル、14-メチルペンタデシニル、13, 13-ジメチルテトラデシニル、ヘプタデシニル、15-メチルヘキサデシニル、オクタデシニル、1-メチルヘプタデシニル、ノナデシニル、アイコシニル、及び、3, 7, 11, 15-テトラメチルヘキサデシニル基のような炭素数2乃至20個の直鎖又は分枝鎖アルキニル基であり、好適には $C_1-C_{10}$ アルキニル基である。

上記において、 $R^9$ の定義における「ヘテロ原子が介在する $C_3-C_{20}$ アルキニル基」は、前述の「 $C_1-C_{20}$ アルキニル基」の内の「 $C_3-C_{20}$ アルキニル基」が、同一又は異なって、1又は2個の、硫黄原子、酸素原子、又は、窒素原子で介在されている基を示し、例えば、1-メチルチオエチニル、2-メチルチオエチニル、1-メチルチオプロピニル、2-メチルチオプロピニル、3-メチルチオプロピニル、2-エチルチオエチニル、2-メチル-2-メチルチオエチニル、1-メチルチオブチニル、2-メチルチオブチニル、3-メチルチオブチニル、2-エチルチオプロピニル、3-メチル-3-メチルチオプロピニル、4-メチルチオペンチニル、3-メチルチオペンチニル、2-メチルチオペンチニル、1-メチルチオペンチニル、3, 3-ジメチルチオブチニル、2, 2-ジメチルチオブチニル、1, 1-ジメチルチオブチニル、1-メチル-2-メチルチオブチニル、1, 3-ジメチルチ

オブチニル、2, 3-ジメチルチオブチニル、2-エチルチオブチニル、1-メチルチオヘキシニル、2-メチルチオヘキシニル、3-メチルチオヘキシニル、4-メチルチオヘキシニル、5-メチルチオヘキシニル、1-プロピルチオブチニル、4-メチル-4-メチルチオペンチニル、1-メチルチオヘプチニル、2-メチルチオヘプチニル、3-メチルチオヘプチニル、4-メチルチオヘプチニル、5-メチルチオヘプチニル、6-メチルチオヘプチニル、1-プロピルチオペンチニル、2-エチルチオヘキシニル、5-メチル-5-メチルチオヘキシニル、3-メチルチオオクチニル、4-メチルチオオクチニル、5-メチルチオオクチニル、6-メチルチオオクチニル、1-プロピルチオヘキシニル、2-エチルチオヘプチニル、6-メチル-6-メチルチオヘプチニル、1-メチルチオノニニル、3-メチルチオノニニル、8-メチルチオノニニル、3-エチルチオオクチニル、3-メチル-7-メチルチオオクチニル、7, 7-ジメチルチオオクチニル、4-メチル-8-メチルチオノニニル、3, 7-ジメチル-11-メチルチオドデシニル、4, 8-ジメチル-12-メチルチオトリデシニル、1-メチルチオペンタデシニル、14-メチルチオペンタデシニル、13-メチル-13-メチルチオテトラデシニル、15-メチルチオヘキサデシニル、1-メチルチオヘプタデシニル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルチオヘキサデシニルのような1又は2個の硫黄原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルキニル基；1-メチルオキシエチニル、2-メチルオキシエチニル、1-メチルオキシプロピニル、2-メチルオキシプロピニル、3-メチルオキシプロピニル、2-エチルオキシエチニル、2-メチル-2-メチルオキシエチニル、1-メチルオキシブチニル、2-メチルオキシブチニル、3-メチルオキシブチニル、2-エチルオキシプロピニル、3-メチル-3-メチルオキシプロピニル、4-メチルオキシペンチニル、3-メチルオキシペンチニル、2-メチルオキシペンチニル、1-メチルオキシペンチニル、3, 3-ジメチルオキシブチニル、2, 2-ジメチルオキシブチニル、1, 1-ジメチルオキシブチニル、1-メチル-2-メチルオキシブチニル、

1, 3-ジメチルオキシブチニル、2, 3-ジメチルオキシブチニル、2-エチルオキシブチニル、1-メチルオキシヘキシニル、2-メチルオキシヘキシニル、3-メチルオキシヘキシニル、4-メチルオキシヘキシニル、5-メチルオキシヘキシニル、1-プロピルオキシブチニル、4-メチル-4-メチルオキシペンチニル、1-メチルオキシヘプチニル、2-メチルオキシヘプチニル、3-メチルオキシヘプチニル、4-メチルオキシヘプチニル、5-メチルオキシヘプチニル、6-メチルオキシヘプチニル、1-プロピルオキシペンチニル、2-エチルオキシヘキシニル、5-メチル-5-メチルオキシヘキシニル、3-メチルオキシオクチニル、4-メチルオキシオクチニル、5-メチルオキシオクチニル、6-メチルオキシオクチニル、1-プロピルオキシヘキシニル、2-エチルオキシヘプチニル、6-メチル-6-メチルオキシヘプチニル、1-メチルオキシノニニル、3-メチルオキシノニニル、8-メチルオキシノニニル、3-エチルオキシオクチニル、3-メチル-7-メチルオキシオクチニル、7, 7-ジメチルオキシオクチニル、4-メチル-8-メチルオキシノニニル、3, 7-ジメチル-11-メチルオキシドデシニル、4, 8-ジメチル-12-メチルオキシトリデシニル、1-メチルオキシペンタデシニル、14-メチルオキシペンタデシニル、13-メチル-13-メチルオキシテトラデシニル、15-メチルオキシヘキサデシニル、1-メチルオキシヘプタデシニル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルオキシヘキサデシニルのような1又は2個の酸素原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルキニル基；1-(N-メチルアミノ)エチニル、2-(N-メチルアミノ)エチニル、1-(N-メチルアミノ)プロピニル、2-(N-メチルアミノ)プロピニル、3-(N-メチルアミノ)プロピニル、2-(N-エチルアミノ)エチニル、2-(N, N-ジメチルアミノ)エチニル、1-(N-メチルアミノ)ブチニル、2-(N-メチルアミノ)ブチニル、3-(N-メチルアミノ)ブチニル、2-(N-エチルアミノ)プロピニル、3-(N, N-ジメチルアミノ)プロピニル、4-(N-メチルアミノ)ペンチニル、3-(N-メチルアミノ)ペ

ンチニル、2-(N-メチルアミノ)ペンチニル、1-(N-メチルアミノ)ペンチニル、3-(N,N-ジメチルアミノ)ブチニル、2-(N,N-ジメチルアミノ)ブチニル、1-(N,N-ジメチルアミノ)ブチニル、1-メチル-2-(N-メチルアミノ)ブチニル、1,3-ジ(N-メチルアミノ)ブチニル、2,3-ジ(N-メチルアミノ)ブチニル、2-(N-エチルアミノ)ブチニル、1-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、2-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、3-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、4-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、5-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、1-(N-プロピルアミノ)ブチニル、4-メチル-4-(N-メチルアミノ)ペンチニル、1-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、2-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、3-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、4-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、5-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、6-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、1-(N-プロピルアミノ)ペンチニル、2-(N-エチルアミノ)ヘキシニル、5-メチル-5-(N-メチルアミノ)ヘキシニル、3-(N-メチルアミノ)オクチニル、4-(N-メチルアミノ)オクチニル、5-(N-メチルアミノ)オクチニル、6-(N-メチルアミノ)オクチニル、1-(N-プロピルアミノ)ヘキシニル、2-(N-エチルアミノ)ヘプチニル、6-メチル-6-(N-メチルアミノ)ヘプチニル、1-(N-メチルアミノ)ノニニル、3-(N-メチルアミノ)ノニニル、8-(N-メチルアミノ)ノニニル、3-(N-エチルアミノ)オクチニル、3-メチル-7-(N-メチルアミノ)オクチニル、7,7-ジ(N-メチルアミノ)オクチニル、4-メチル-8-(N-メチルアミノ)ノニニル、3,7-ジメチル-11-(N-メチルアミノ)ドデシニル、4,8-ジメチル-12-(N-メチルアミノ)トリデシニル、1-(N-メチルアミノ)ペンタデシニル、14-(N-メチルアミノ)ペンタデシニル、13-メチル-13-(N-メチルアミノ)テトラデシニル、15-(N-メチルアミノ)ヘキサデシニル、1-(N-メチルアミノ)ヘプタデシニル、及び、3,7,11-トリメチル-15-(N-メチルアミノ)ヘキサデ

ジニルのような1又は2個の窒素原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルキニル基であり、好適には、ヘテロ原子が介在する $C_3-C_{10}$ アルキニル基である。

上記において、 $R^9$ の定義における「アリール基又は芳香族複素環基で置換された $C_2-C_{20}$ アルキニル基」は、前述の「 $C_2-C_{20}$ アルキニル基」が、同一又は異なって、1又は3個の、前述の「アリール基」又は前述の「芳香族複素環基」で置換された基を示す。

上記において、 $R^9$ の定義における「 $C_2-C_{20}$ アルケニル基」は、例えば、エテニル、2-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-エチル-2-プロペニル、2-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、ヘプテニル、1-メチルヘキセニル、2-メチルヘキセニル、3-メチルヘキセニル、4-メチルヘキセニル、5-メチルヘキセニル、1-プロピルブテニル、4, 4-ジメチルペンテニル、オクテニル、1-メチルヘプテニル、2-メチルヘプテニル、3-メチルヘプテニル、4-メチルヘプテニル、5-メチルヘプテニル、6-メチルヘプテニル、1-プロピルペンテニル、2-エチルヘキセニル、5, 5-ジメチルヘキセニル、ノネニル、3-メチルオクテニル、4-メチルオクテニル、5-メチルオクテニル、6-メチルオクテニル、1-プロピルヘキセニル、2-エチルヘプテニル、6, 6-ジメチルヘプテニル、デセニル、1-メチルノネニル、3-メチルノネニル、8-メチルノネニル、3-エチルオクテニル、3, 7-ジメチルオクテニル、7, 7-ジメチルオクテニル、ウンデセニル、4, 8-ジメチルノネニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデ



セニル、ペンタデセニル、3, 7, 11-トリメチルドデセニル、ヘキサデセニル、4, 8, 12-トリメチルトリデセニル、1-メチルペンタデセニル、14-メチルペンタデセニル、13, 13-ジメチルテトラデセニル、ヘプタデセニル、15-メチルヘキサデセニル、オクタデセニル、1-メチルヘプタデセニル、ノナデセニル、アイコセニル、及び、3, 7, 11, 15-テトラメチルヘキサデセニル基のような炭素数2乃至20の直鎖又は分枝鎖アルケニル基を挙げることができ、好適にはC<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>アルケニル基である。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「ヘテロ原子が介在するC<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>アルケニル基」は、前記「C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>アルケニル基」の内の「C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>アルケニル基」が、同一又は異なって、1又は2個の、硫黄原子、酸素原子、又は、窒素原子で介在されている基を示し、例えば、1-メチルチオエテニル、2-メチルチオエテニル、1-メチルチオプロペニル、2-メチルチオプロペニル、3-メチルチオプロペニル、2-エチルチオエテニル、2-メチル-2-メチルチオエテニル、1-メチルチオブテニル、2-メチルチオブテニル、3-メチルチオブテニル、2-エチルチオプロペニル、3-メチル-3-メチルチオプロペニル、4-メチルチオペンテニル、3-メチルチオペンテニル、2-メチルチオペンテニル、1-メチルチオペンテニル、3, 3-ジメチルチオブテニル、2, 2-ジメチルチオブテニル、1, 1-ジメチルチオブテニル、1-メチル-2-メチルチオブテニル、1, 3-ジメチルチオブテニル、2, 3-ジメチルチオブテニル、2-エチルチオブテニル、1-メチルチオヘキセニル、2-メチルチオヘキセニル、3-メチルチオヘキセニル、4-メチルチオヘキセニル、5-メチルチオヘキセニル、1-プロピルチオブテニル、4-メチル-4-メチルチオペンテニル、1-メチルチオヘプテニル、2-メチルチオヘプテニル、3-メチルチオヘプテニル、4-メチルチオヘプテニル、5-メチルチオヘプテニル、6-メチルチオヘプテニル、1-プロピルチオペンテニル、2-エチルチオヘキセニル、5-メチル-5-メチルチオヘキセニル、3-メチルチオオクテニル、4-メチルチ

オオクテニル、5-メチルチオオクテニル、6-メチルチオオクテニル、1-プロピルチオヘキセニル、2-エチルチオヘプテニル、6-メチル-6-メチルチオヘプテニル、1-メチルチオノネニル、3-メチルチオノネニル、8-メチルチオノネニル、3-エチルチオオクテニル、3-メチル-7-メチルチオオクテニル、7, 7-ジメチルチオオクテニル、4-メチル-8-メチルチオノネニル、3, 7-ジメチル-11-メチルチオドデセニル、4, 8-ジメチル-12-メチルチオトリデセニル、1-メチルチオペンタデセニル、14-メチルチオペンタデセニル、13-メチル-13-メチルチオテトラデセニル、15-メチルチオヘキサデセニル、1-メチルチオヘプタデセニル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルチオヘキサデセニルのような1又は2個の硫黄原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルケニル基；1-メチルオキシエテニル、2-メチルオキシエテニル、1-メチルオキシプロペニル、2-メチルオキシプロペニル、3-メチルオキシプロペニル、2-エチルオキシエテニル、2-メチル-2-メチルオキシエテニル、1-メチルオキシブテニル、2-メチルオキシブテニル、3-メチルオキシブテニル、2-エチルオキシプロペニル、3-メチル-3-メチルオキシプロペニル、4-メチルオキシペンテニル、3-メチルオキシペンテニル、2-メチルオキシペンテニル、1-メチルオキシペンテニル、3, 3-ジメチルオキシブテニル、2, 2-ジメチルオキシブテニル、1, 1-ジメチルオキシブテニル、1-メチル-2-メチルオキシブテニル、1, 3-ジメチルオキシブテニル、2, 3-ジメチルオキシブテニル、2-エチルオキシブテニル、1-メチルオキシヘキセニル、2-メチルオキシヘキセニル、3-メチルオキシヘキセニル、4-メチルオキシヘキセニル、5-メチルオキシヘキセニル、1-プロピルオキシブテニル、4-メチル-4-メチルオキシペンテニル、1-メチルオキシヘプテニル、2-メチルオキシヘプテニル、3-メチルオキシヘプテニル、4-メチルオキシヘプテニル、5-メチルオキシヘプテニル、6-メチルオキシヘプテニル、1-プロピルオキシペンテニル、2-エチルオキシヘキセニル、5-メチル-5-メチル

オキシヘキセニル、3-メチルオキシオクテニル、4-メチルオキシオクテニル、5-メチルオキシオクテニル、6-メチルオキシオクテニル、1-プロピルオキシヘキセニル、2-エチルオキシヘプテニル、6-メチル-6-メチルオキシヘプテニル、1-メチルオキシノネニル、3-メチルオキシノネニル、8-メチルオキシノネニル、3-エチルオキシオクテニル、3-メチル-7-メチルオキシオクテニル、7, 7-ジメチルオキシオクテニル、4-メチル-8-メチルオキシノネニル、3, 7-ジメチル-11-メチルオキシドデセニル、4, 8-ジメチル-12-メチルオキシトリデセニル、1-メチルオキシペンタデセニル、14-メチルオキシペンタデセニル、13-メチル-13-メチルオキシテトラデセニル、15-メチルオキシヘキサデセニル、1-メチルオキシヘプタデセニル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-メチルオキシヘキサデセニルのような1又は2個の酸素原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルケニル基；1-(N-メチルアミノ)エテニル、2-(N-メチルアミノ)エテニル、1-(N-メチルアミノ)プロペニル、2-(N-メチルアミノ)プロペニル、3-(N-メチルアミノ)プロペニル、2-(N-エチルアミノ)エテニル、2-(N, N-ジメチルアミノ)エテニル、1-(N-メチルアミノ)ブテニル、2-(N-メチルアミノ)ブテニル、3-(N-メチルアミノ)ブテニル、2-(N-エチルアミノ)プロペニル、3-(N, N-ジメチルアミノ)プロペニル、4-(N-メチルアミノ)ペンテニル、3-(N-メチルアミノ)ペンテニル、2-(N-メチルアミノ)ペンテニル、1-(N-メチルアミノ)ペンテニル、3-(N, N-ジメチルアミノ)ブテニル、2-(N, N-ジメチルアミノ)ブテニル、1-(N, N-ジメチルアミノ)ブテニル、1-メチル-2-(N-メチルアミノ)ブテニル、1, 3-ジ(N-メチルアミノ)ブテニル、2, 3-ジ(N-メチルアミノ)ブテニル、2-(N-エチルアミノ)ブテニル、1-(N-メチルアミノ)ヘキセニル、2-(N-メチルアミノ)ヘキセニル、3-(N-メチルアミノ)ヘキセニル、4-(N-メチルアミノ)ヘキセニル、5-(N-メチルアミノ)ヘキセニル、1-

(N-プロピルアミノ) ブテニル、4-メチル-4-(N-メチルアミノ) ペンテニル、1-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、2-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、3-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、4-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、5-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、6-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、1-(N-プロピルアミノ) ペンテニル、2-(N-エチルアミノ) ヘキセニル、5-メチル-5-(N-メチルアミノ) ヘキセニル、3-(N-メチルアミノ) オクテニル、4-(N-メチルアミノ) オクテニル、5-(N-メチルアミノ) オクテニル、6-(N-メチルアミノ) オクテニル、1-(N-プロピルアミノ) ヘキセニル、2-(N-エチルアミノ) ヘプテニル、6-メチル-6-(N-メチルアミノ) ヘプテニル、1-(N-メチルアミノ) ノネニル、3-(N-メチルアミノ) ノネニル、8-(N-メチルアミノ) ノネニル、3-(N-エチルアミノ) オクテニル、3-メチル-7-(N-メチルアミノ) オクテニル、7, 7-ジ(N-メチルアミノ) オクテニル、4-メチル-8-(N-メチルアミノ) ノネニル、3, 7-ジメチル-11-(N-メチルアミノ) ドデセニル、4, 8-ジメチル-12-(N-メチルアミノ) トリデセニル、1-(N-メチルアミノ) ペンタデセニル、14-(N-メチルアミノ) ペンタデセニル、13-メチル-13-(N-メチルアミノ) テトラデセニル、15-(N-メチルアミノ) ヘキサデセニル、1-(N-メチルアミノ) ヘプタデセニル、及び、3, 7, 11-トリメチル-15-(N-メチルアミノ) ヘキサデセニルのような1又は2個の窒素原子で介在されている炭素数3乃至20個のアルケニル基を挙げることができ、好適には、ヘテロ原子が介在するC<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>アルケニル基である。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「アリール基又は芳香族複素環基で置換されたC<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>アルケニル基」は、前記「C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>アルケニル基」が、同一又は異なって、1又は3個の、前記「アリール基」又は前記「芳香族複素環基」で置換された基を示す。

上記において、R<sup>9</sup>の定義における「アリール基又は芳香族複素環基で置換

されたヘテロ原子が介在する  $C_2-C_{20}$  アルキル基」は、前記「ヘテロ原子が介在する  $C_2-C_{20}$  アルキル基」が、同一又は異なって、1又は3個の、前記「アリール基」又は前記「芳香族複素環基」で置換された基を示す。

上記において、 $R^9$  の定義における「 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基」は、前記「シクロアルキル基」と同意義を示す。

## 第B1工程

第B1工程は、一般式(X)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(VIII)の一方のヒドロキシ基のみを、不活性溶媒の存在又は非存在下(好適には存在下)、リパーゼの存在下に、化合物(IX)を用いて選択的にアシル化することにより行なわれる。

上記反応において使用される「リパーゼ」は、特に限定はなく、原料化合物の種類により最適なもの異なるが、好ましくは、*Pseudomonas* sp.、*Pseudomonas fluorescens*、*Pseudomonas cepacia*、*Chromobacterium viscosum*、*Aspergillus niger*、*Aspergillus oryzae*、*Candida antarctica*、*Candida cylindracea*、*Candida lipolytica*、*Candida rugosa*、*Candida utilis*、*Penicillium roqueforti*、*Rhizopus arrhizus*、*Rhizopus delemar*、*Rhizopus javanicus*、*Rhizomucor miehei*、*Rhizopus niveus*、*Humicola lanuginosa*、*Mucor javanicus*、*Mucor miehei*、*Thermus aquaticus*、*Thermus flavus*、*Thermus thermophilus*等やhuman pancreas、hog pancreas、porcine pancreas、wheat germ由来のリパーゼであり、酵素は部分的に又は完全に精製して用いることができるばかりではなく、固定化した形態で使うことができる。

最も好適には、*Pseudomonas* sp.を固定化したもの(例えば、immobilized lipase from *Pseudomonas* sp. (TOYOBO社))である。

上記反応において使用される化合物(IX)において最適な化合物としては、原料化合物の種類により最適なもの異なるが、*n*-ヘキサン酸 ビニルエステル、*n*-ヘプタン酸 ビニルエステル、*n*-ペンタン酸 ビニルエ

ステル、酢酸 ビニルエステル等の直鎖状脂肪族カルボン酸 ビニルエステルであり、最も好適には、*n*-ヘキサン酸 ビニルエステルである。

上記反応において使用される不活性溶媒は特に限定はなく、化合物 (IX) のみでも良いし、また原料化合物の種類により最適なものが異なるが、各種有機溶媒、含水有機溶媒を使用することができ、好適には、ジイソプロピルエーテル、*t*-ブチルメチルエーテル、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類；*n*-ヘキサン、*n*-ペンタンのような脂肪族炭化水素類；ベンゼン、トルエンのような芳香族炭化水素類；及びジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類を挙げることができ、更に好適には、エーテル類であり、最も好適には、ジイソプロピルエーテル又は *t*-ブチルメチルエーテルである。

反応温度は、原料化合物、使用される溶媒、使用されるリパーゼの種類等によって異なるが、通常、-50℃乃至50℃であり、好適には、0℃乃至40℃である。

反応時間は、原料化合物、使用される溶媒、使用されるリパーゼ、及び、反応温度等によって異なるが、通常、15分乃至150時間であり、好適には30分乃至24時間である。

## 第B2工程

第B2工程は、一般式 (XI) を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、酸化剤の存在下、化合物 (X) のアルコール部分をアルデヒドに酸化することにより行なわれる。

上記反応における酸化反応としては、一級アルコールからアルデヒドを生成する酸化反応であれば、特に限定はないが、例えば、ジクロロメタン中、ピリジン及びクロム酸を用いて行われるCollins酸化；ジクロロメタン中、塩化クロム酸ピリジニウム(PCC)を用いて行われるPCC酸化；ジクロロメタン中、二クロム酸ピリジニウム(PDC)を用いて行われるPDC酸化；ジクロロメタン中、親電子剤（例えば無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、塩化チオニル

、塩化スルフリル、塩化オキザリル、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジフェニルケテンー p -トリルイミン、N, N -ジエチルアミノアセチレン、三酸化硫黄・ピリジン錯体など) 及びジメチルスルホキシド(DMSO)を用いて行われる、Swern酸化のような、DMSO酸化; 及びジクロロメタン若しくはベンゼン中、二酸化マンガンを用いて行われる二酸化マンガン酸化などをあげることができ、好適には、ジクロロメタン中で行われる、PCC酸化、PDC酸化又はSwern酸化である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、酸化剤の種類等によって異なるが、通常、-78℃乃至80℃で行われ、好適には、-78℃乃至30℃である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、酸化剤の種類、反応温度等によって異なるが、通常10分間乃至48時間であり、好適には、30分間乃至24時間である。

### 第B3工程

第B3工程は、一般式(X I I I)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物(X I)に、化合物(X I I)を反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定されないが、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類; トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類; ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類; アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類; ホルムアミド、N, N -ジメチルホルムアミド、N, N -ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類; メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類; 又は水を挙げることができ、好適にはエーテル類(最も好適にはテト

ラヒドロフラン)である。

上記反応に使用される塩基としては、化合物(X I)のアルデヒド部分以外の部分を変化させないものであれば、特に限定されず、例えば、前述のA法第A 2工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適にはアルカリ金属アルコキシド類(最も好適には、カリウムt-ブトキシド)である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ で行われるが、好適には $-50^{\circ}\text{C}$ 乃至 $150^{\circ}\text{C}$ (最も好適には $0^{\circ}\text{C}$ )である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、塩基、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至48時間(好適には、30分間乃至8時間)である。

#### 第B 4工程

第B 4工程は、一般式(X I V)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物(X I I I)を加水分解することにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、反応を阻害せず、出発原料をある程度溶解するものであれば、特に限定はされず、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、t-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ホルムアミド、N, N-ジメチルホルムアミド、N, N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；又は上記溶媒の混合溶媒；あるいは上記溶媒と水との混合溶媒を挙げる事ができ、好適には、アルコール類とエーテル類と水との混合溶媒またはアルコール類と水との混合溶媒(最も好適にはメタノール



とテトラヒドロフランと水との混合溶媒又はメタノールと水との混合溶媒)である。

上記反応に使用される塩基としては、化合物(X I I I)のアシル部分以外の部分を変化させないものであれば、特に限定されず、例えば、前述のA法第A 2工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、アルカリ金属水酸化物類(最も好適には水酸化ナトリウム)である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$ 乃至 $150^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $-50^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ (最も好適には、室温付近)である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至48時間(最も好適には、30分間乃至6時間)である。

#### 第B 5工程

第B 5工程は、一般式(X V)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物(X V)を塩基と反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；ホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルホルムアミド、*N*, *N*-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；水；又は上記溶媒の混合溶媒；あるいは上記溶媒と水との混合溶媒を挙げることができ、好適には、エーテル類又はアミド類(最も好適にはテトラヒドロフラン)である。

上記反応に使用される塩基としては、通常の反応において塩基として使用

されるものであれば、特に限定はないが、例えば、前述のA法第A2工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、金属アルコキシド類（最も好適には、カリウム-*t*-ブトキシド）である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$ 乃至 $150^{\circ}\text{C}$ で行われ、好適には $-50^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ （最も好適には、 $0^{\circ}\text{C}$ 乃至室温）である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、塩基、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至48時間（好適には、30分間乃至8時間）である。

この第B5工程は、一般式（XIV）を有する化合物のアミノ基の保護基を脱保護した後、N，N-カルボニルジイミダゾールや炭酸ジメチル、炭酸ジエチルのようなアシル化剤と反応させることによっても行うことができる。

#### 第B6工程

第B6工程は、一般式（XVI）を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、還元剤の存在下、化合物（XV）を還元（好適には、水素雰囲気下、接触還元）することにより行われる。

接触還元反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はされないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；ホルムアミド、N，N-ジメチルホルムアミド、N，N-ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレング

リコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；酢酸、塩酸のような有機酸類；水；上記溶媒と水との混合溶媒を挙げることができる。好適には、アルコール類又はエーテル類（最も好適にはメタノール）である。

接触還元反応に使用される還元剤としては、通常の接触還元反応において使用されるものであれば特に限定されないが、例えば、前述のA法第A3工程又は第A4工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、パラジウム-炭素（最も好適には10%パラジウム-炭素）である。

水素圧は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われ、好適には1気圧である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、還元剤の種類等によって異なるが、通常、-20℃乃至200℃で行われるが、好適には0℃乃至100℃（最も好適には20℃乃至30℃）である。

反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬又は使用される溶媒の種類によって異なるが、通常、5分間乃至96時間であり、好適には15分間乃至24時間（最も好適には30分間乃至2時間）である。

## 第B7工程

第B7工程は、一般式(XV I I)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物(XV I)を加水分解することにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、特に限定はされず、例えば、前述の第B4工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、アルコール類とエーテル類との混合溶媒またはアルコール類と水との混合溶媒（最も好適にはメタノールとテトラヒドロフランと水との混合溶媒又はメタノールと水との混合溶媒）である。

上記反応に使用される塩基としては、化合物(XV I)の加水分解反応に

不活性なものであれば、特に限定されず、例えば、前述の第B4工程において使用されるものと同様のものを挙げることができ、好適には、アルカリ金属水酸化物類(最も好適には水酸化カリウム又は水酸化ナトリウム)である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ であり、好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $180^{\circ}\text{C}$ (最も好適には、 $20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $120^{\circ}\text{C}$ )である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至10日間(最も好適には、2時間乃至5日間)である。

#### 第B8工程

第B8工程は、所望の工程で一般式(I V)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、化合物(X V I I)のヒドロキシ基とアミノ基を、アルキル化又は保護することにより行われる。

ヒドロキシ基及びアミノ基をアルキル化又は保護する方法は、一般に有機合成化学の技術において周知の方法、例えば、Protective Groups in Organic Synthesis(Third Edition, 1999, John Wiley & Sons, Inc.社発行)に記載された方法により行うことができ、以下のようにして行うことができる。

アミノ基をアルキル化又は保護する方法としては、例えば、化合物(X V I I)を、不活性溶媒中(好適には、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；又はメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；)、塩基(好適には、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、*N*-メチルモルホリン、ピリジンのような有機アミン類)の存在下又は非存在下、下記化合物



[上記式中、 $R^{1a}$  は低級アルキル基又はアミノ基の保護基（前述したものと同意義を示す。）を示し、 $Q$  は前述したものと同意義を示す。]

と、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $150^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $-50^{\circ}\text{C}$  乃至  $100^{\circ}\text{C}$ 、最も好適には、室温付近）で、10分間乃至48時間（好適には、20分間乃至8時間）反応させることにより行なわれる。

ヒドロキシ基をアルキル化又は保護する方法としては、例えば、化合物（XVII）を、不活性溶媒中（好適には、クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類；ホルムアミド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類）、塩基の存在下（好適には、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物類；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、 $N$ -メチルモルホリン、ピリジンのような有機アミン類）、下記化合物



[上記式中、 $R^{3a}$  は、低級アルキル基又はヒドロキシ基の保護基（前述したものと同意義を示す。）を示し、 $Q$  は前述したものと同意義を示す。]と、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $150^{\circ}\text{C}$ （好適には、 $-50^{\circ}\text{C}$  乃至  $100^{\circ}\text{C}$ 、最も好適には、室温付近）で、10分間乃至48時間（好適には、20分間乃至8時間）反応させることにより行なわれる。

アミノ基のアルキル化又は保護化とヒドロキシ基のアルキル化又は保護化は、順不同で希望する反応を順次実施することができる。

B法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有

機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオンHP-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

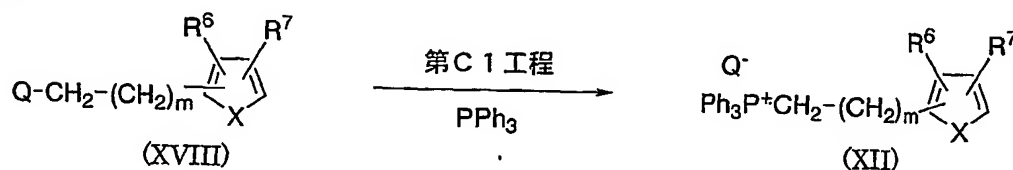
尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

原料化合物（VII）及び（IX）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法[原料化合物（VII）：J. Org. Chem., 64, 8220 (1999)]に従って容易に製造される。

#### （C法）

C法は、一般式（XI）を有する化合物を製造する工程である。

C法



上記式中、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、X、m、Q及びPhは、前述したものと同意義を示す。

## 第C1工程

第C1工程は、化合物(XII)を製造する工程であり、不活性溶媒中、一般式(XVII)を有する化合物をトリフェニルホスフィンと反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、エーテル類又はニトリル類である。

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ で行われ、好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $150^{\circ}\text{C}$ (最も好適には、 $20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $120^{\circ}\text{C}$ )である。

反応時間は、主に反応温度、原料化合物、使用される溶媒の種類によって異なるが、通常、5分間乃至96時間であり、好適には15分乃至48時間(最も好適には、1時間乃至8時間)である。

本工程の目的化合物(XII)は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20(ファルマシア社製)、アンバーライトXAD-11(ローム・アンド・ハース社製)、ダイヤイオンHP-20(三菱化学社製)のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロ

マトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

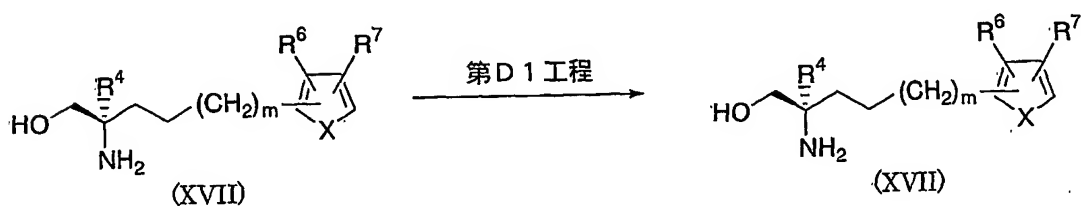
尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記工程の反応終了後、上記分離精製手段によって行なうことができる。

原料化合物（X V I I I）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法[X = Oの場合：J. Am. Chem. Soc., 49, 1066 (1927)、X = N-Meの場合：J. Org. Chem., 52, 19 (1987)]に従って容易に製造される。

#### (D法)

D法は、一般式（X V I I）を有する化合物の光学純度を上げるための工程である。

#### D法



上記式中、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{R}^7$ 、X及びmは、前述したものと同意義を示す。

#### 第D1工程

第D1工程は、化合物（X V I I）の光学純度を上げる工程であり、不活性溶媒中、化合物（X V I I）を光学活性な有機酸と処理し、塩とし、必要に応じて再結晶をすることにより、光学純度を上げた後、塩基で処理することにより、一般式（X V I I）を有するフリー体に戻す工程である。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれ



ば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジエチルのようなエステル類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；メタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*t*-ブタノール、イソアミルアルコール、ジエチレングリコール、グリセリン、オクタノール、シクロヘキサノール、メチルセロソルブのようなアルコール類；アセトニトリル、プロピオニトリルのようなニトリル類；水；又は上記溶媒と水との混合溶媒；であり、好適には、アルコール類（最も好適には、メタノール、エタノール）又はアルコール類と水との混合溶媒である。

上記反応に使用される光学活性な有機酸としては、特に限定はされないが、例えば、酒石酸、マンデル酸、カンファー-10-スルホン酸であり、好適には酒石酸である。

得られた塩をフリー体（XV I I）に戻すのは、有機溶媒と塩基を用いた通常の抽出操作により簡便に行うことができる。

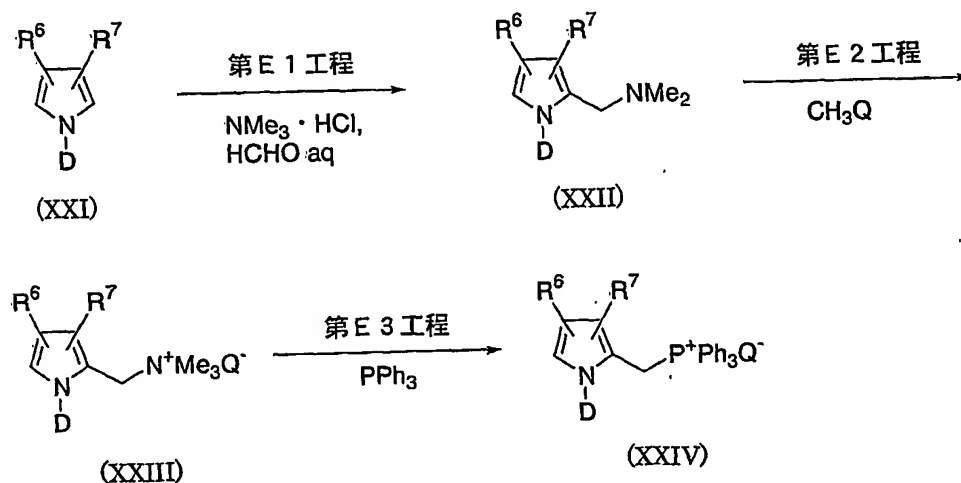
D法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）

、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオンHP-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

### （E法）

E法は、一般式（XXIV）を有する化合物を製造する工程であり、C法の $X=N-D$ 、 $m=0$ の化合物を合成する際に特に有用な方法であり、文献記載の方法（J. Org. Chem., 52, 19 (1987)）に準じて行うことができる。

#### E法



上記式中、D、 $R^6$ 、 $R^7$ 及びQは、前述したものと同意義を示す。

#### 第E1工程

第E1工程は、一般式（XXII）を有する化合物を製造する工程であり、公知の方法（例えば、J. Am. Chem. Soc, 73, 4921 (1951)）に記載の方法等

)に準じて、化合物(X X I)をホルマリンおよびジメチルアミン塩酸塩と反応させることにより行われる。

### 第E 2工程

第E 2工程は、一般式(X X I I I)を有する化合物を製造する工程であり、化合物(X X I I)をヨウ化メチル等のハロゲン化メチルと反応させ、四級塩とする工程である。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、アルコール類である。

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$ 乃至 $200^{\circ}\text{C}$ で行われ、好適には $0^{\circ}\text{C}$ 乃至 $50^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、主に反応温度、原料化合物、使用される溶媒の種類によって異なるが、通常、5分間乃至96時間であり、好適には15分乃至48時間(最も好適には、1時間乃至8時間)である。

### 第E 3工程

第E 3工程は、化合物(X X I V)を製造する工程であり、不活性溶媒中、一般式(X X I I I)を有する化合物をトリフェニルホスフィンと反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、本反応に不活性なものであれば特に限定はないが、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、エーテル類又はニトリル類（最も好適には、アセトニトリル）である。

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、室温乃至200℃で行われ、好適には0℃乃至150℃（最も好適には、20℃乃至100℃）である。

反応時間は、主に反応温度、原料化合物、使用される溶媒の種類によって異なるが、通常、5分間乃至96時間であり、好適には15分乃至48時間（最も好適には、1時間乃至8時間）である。

E法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオ

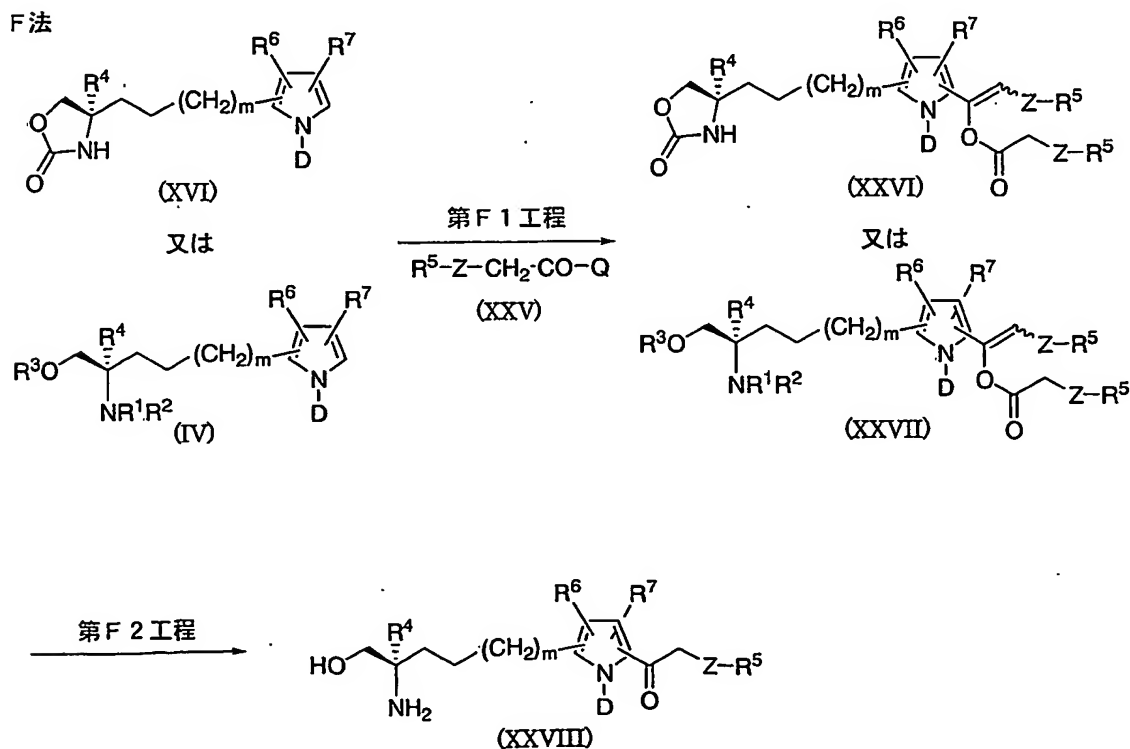
ンHP-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

原料化合物（XXI）は、公知か、公知の方法又はそれに類似した方法に従って容易に製造される。

#### （F法）

F法は、一般式（XVI）又は（IV）より、一般式（XXVII）を有する化合物を製造する工程であり、A法の別法の一つである。



上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、D、Q、Z及びmは、前述したものと同意義を示す。

#### 第F1工程

第F1工程は、一般式(XXVI)又は(XXVII)を有する化合物を製造する工程であり、一般式(XVI)又は(IV)を有する化合物を、不活性溶媒中、塩基の存在下、一般式(XXV)を有する酸ハライドと反応させることにより行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、特に限定はされず、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、芳香族炭化水素類（特に好適には、ベンゼン、トルエン又はキシレン）である。

上記反応に使用される塩基としては、化合物(XXV)を活性化するものであれば、特に限定されず、例えば、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン)又は4-ピロリジノピリジンである。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至200℃であり、好適には室温乃至150℃である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至7日間であり、好適には6時間乃至3日間である。

## 第F 2 工程

第F 2 工程は、一般式 (X X V I I I) を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物 (X X V I) 又は化合物 (X X V I I) を加水分解することにより行われる。加水分解反応は、前述した第B 7 工程と同様にして行われる。

F 法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム - シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオンHP-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

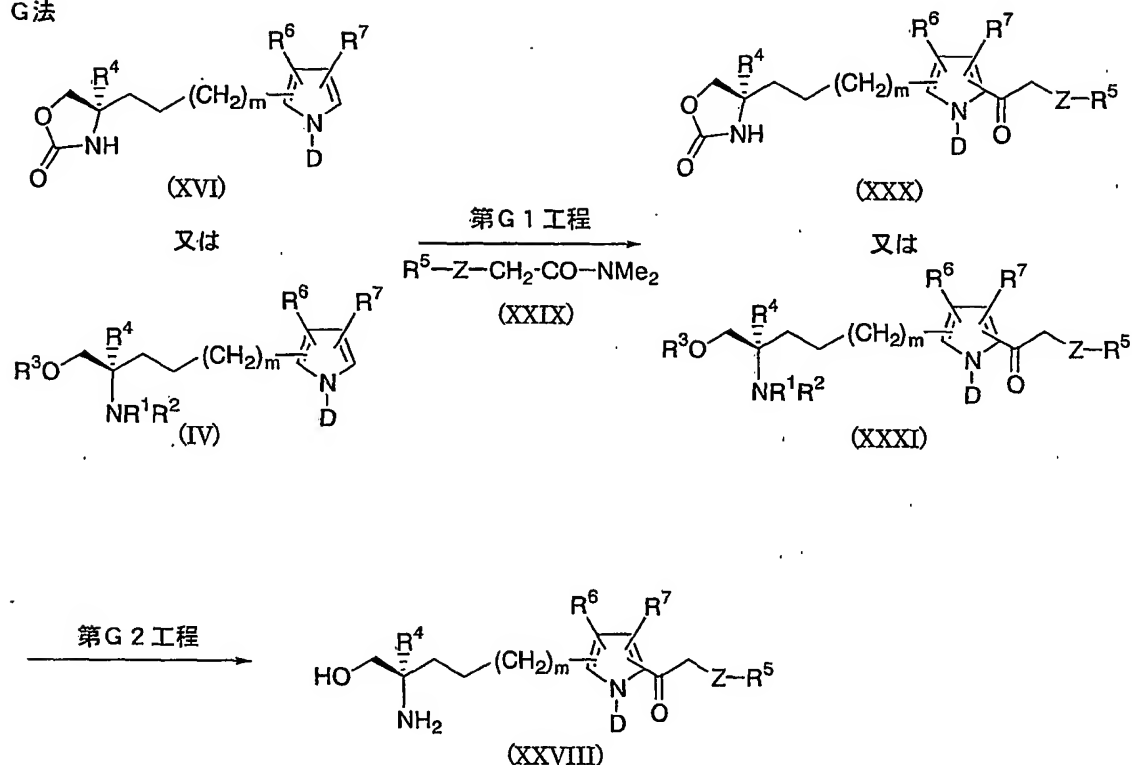
尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

## (G 法)

G 法は、一般式 (X V I) 又は (I V) より、一般式 (X X V I I I) を

有する化合物を製造する工程であり、F法の別法の一つである。

G法



上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $D$ 、 $Z$ 及び $m$ は、前述したものと同意義を示す。

### 第G1工程

第G1工程は、一般式(XXX)又は(XXXI)を有する化合物を製造する工程であり、一般式(XVI)又は(IV)を有する化合物を、不活性溶媒中、オキシ塩化リン又は塩化オキザリルの存在下、化合物(XXIX)のようなアミド誘導体と反応させることにより行われる。この反応は公知の方法(例えば、J. Med. Chem., 40, 3381 (1997)に記載の方法等)に準じて行われる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、特に限定はされず、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロ



ロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；アセトニトリル、プロピオニトリルのような低級アルキルニトリル類；メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールのような低級アルキルアルコール類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、芳香族炭化水素類（特に好適には、ベンゼン又はトルエン）である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、塩基の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至200℃であり、好適には室温乃至150℃である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至7日間であり、好適には6時間乃至3日間である。

## 第G2工程

第G2工程は、一般式（XXVII）を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物（XXX）又は化合物（XXXI）を加水分解することにより行われる。加水分解反応は、前述した第B7工程と同様にして行われる。

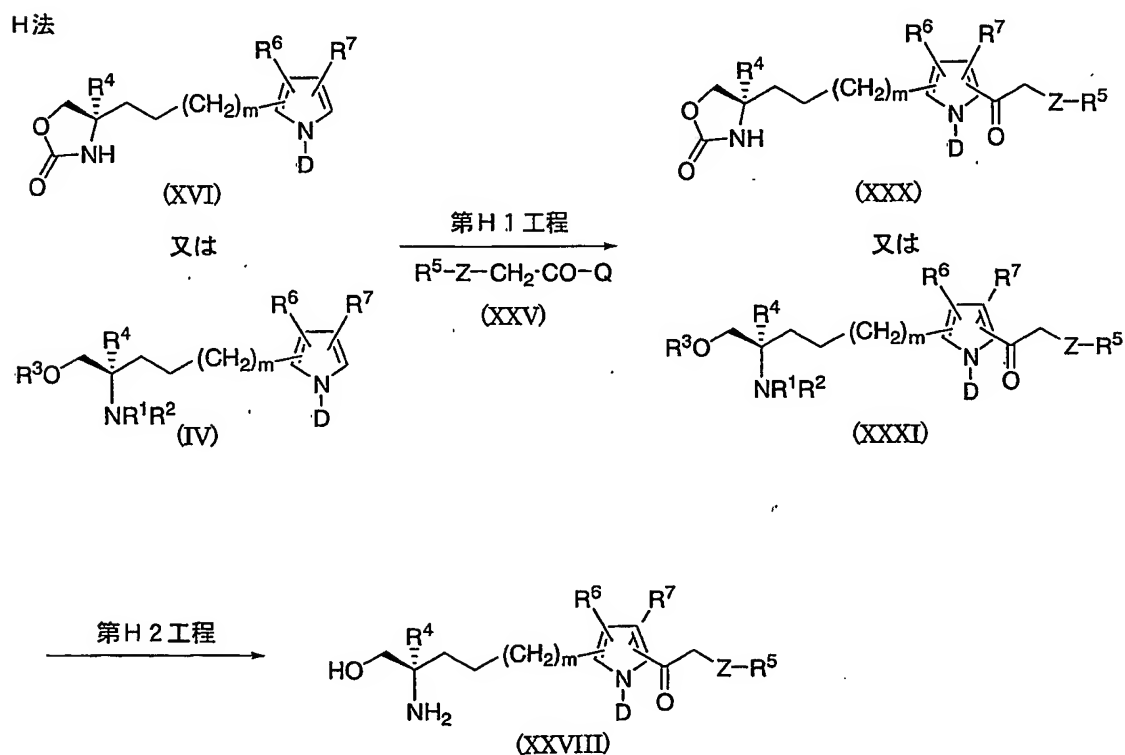
G法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオンH

P-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

#### （H法）

H法は、一般式（XVI）又は（IV）より、一般式（XXVII）を有する化合物を製造する工程であり、F法の別法の一つである。



上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、D、Q、Z及びmは、

前述したものと同意義を示す。

#### 第H1工程

第H1工程は、一般式 (XXX) 又は (XXXI) を有する化合物を製造する工程であり、一般式 (XVI) 又は (IV) を有する化合物を、不活性溶媒中、公知の方法 (例えば、*Synth. Commun.*, 19, 2721 (1989) に記載の方法等) に準じて、塩化アルミニウムのようなルイス酸の存在下、化合物 (XXV) のような酸ハライドと Friedel-Crafts 反応させることにより行うか、若しくは、一般式 (XVI) 又は (IV) を有する化合物を、不活性溶媒中、公知の方法 (例えば、*Bioorg. Med. Chem.*, 9, 621 (2001) に記載の方法等) に準じて、Grignard 試薬と処理した後、化合物 (XXV) のような酸ハライドと反応させることにより行うことができる。

上記反応に使用される不活性溶媒としては、特に限定はされず、例えば、ヘキサン、ヘプタン、リグロイン、石油エーテルのような脂肪族炭化水素類；トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチレングリコールジメチルエーテルのようなエーテル類；又はアセトン、メチルエチルケトンのような低級アルキルケトン類が挙げられ、好適には、前者の場合には、ハロゲン化炭化水素類 (特に、ジクロロメタン、ジクロロエタン) であり、後者の場合には、エーテル類 (特に、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン) である。

反応温度は、原料化合物、溶媒、試薬の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至100℃であり、好適には0℃乃至50℃である。

反応時間は、原料化合物、塩基、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、15分乃至24時間であり、好適には1時間乃至12時間である。

## 第H2工程

第H2工程は、一般式(XXVIIII)を有する化合物を製造する工程であり、不活性溶媒中、塩基の存在下、化合物(XXX)又は化合物(XXXI)を加水分解することにより行われる。加水分解反応は、前述した第G2工程と同様にして行われる。

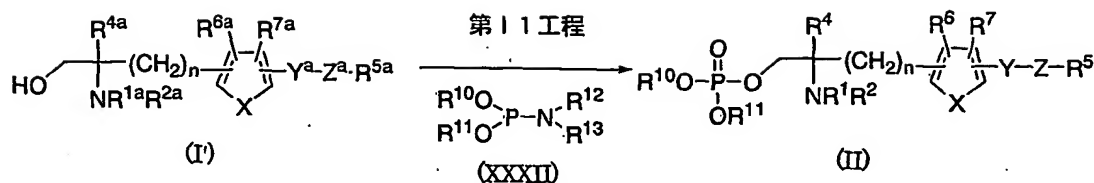
H法の各工程の目的化合物は、常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウム-シリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法；セファデックスLH-20（ファルマシア社製）、アンバーライトXAD-11（ローム・アンド・ハース社製）、ダイヤイオンHP-20（三菱化学社製）のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又はシリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法（好適には高速液体カラムクロマトグラフィー）を適宜組み合わせ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

尚、異性体を分離する必要がある場合には、上記各工程の反応終了後、又は、所望工程の終了後の適切な時期に、上記分離精製手段によって行なうことができる。

## (I法)

化合物(II)は、前述したA法乃至H法を適宜選択して製造されるが、以下に示すI法によっても製造することができる。

I法



上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 及び $n$ は、前述したものと同意義を示す。 $R^{1a}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{7a}$ 、 $Y^a$ 及び $Z^a$ は、各々、 $R^{1a}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{7a}$ 、 $Y^a$ 及び $Z^a$ に含まれるアミノ、ヒドロキシ及び／又はカルボキシル基が、保護されてもよいアミノ、ヒドロキシ及び／又はカルボキシル基である他、それぞれ、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $Y$ 及び $Z$ の基の定義におけるものと同意義を示し、 $R^{12}$ 及び $R^{13}$ は、同一又は異なって、低級アルキル基（特に、エチル基またはイソプロピル基）を示す。

### 第I工程

第I工程は、一般式（I）を有する化合物を製造する工程であり、一般式（I）の $R^3$ が水素原子であるアルコール体（I'）と化合物（XXXII）とを反応させて亜リン酸エステル体とし、次いで、酸化剤と反応させ、所望により、アミノ基の保護基を除去し、ヒドロキシ基の保護基を除去し、カルボキシル基の保護基を除去し、リン酸基の保護基を除去することにより行われる。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $Y$ 及び $Z$ におけるヒドロキシ基、アミノ基及び／又はカルボキシル基の保護基の除去は、前述の第A7工程における保護基の除去と同様に行われる。

所望の反応は、適宜順序を変えて行うことができ、保護基の除去は、適宜反応条件を選択して、選択的に除去することができる。

一級水酸基を有する化合物をリン酸エステル体に導くには、有機合成化学

の分野で一般的に使用される方法に準じて行うことができる。例えば、実験化学講座 22 (第4版:丸善)「有機合成 IV」第3章「リン酸エステル」に記載の方法により、容易に導くことが可能である。実際には以下のような方法が好適である。

すなわち、アルコール体 (I') と化合物 (XXX II) とを、不活性溶媒中、活性化剤存在下、反応させ亜リン酸エステル体を製造し、次いで、不活性溶媒中、酸化剤と反応させる方法である。

化合物 (I') と化合物 (XXX II) との反応において使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類或は上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類又はエーテル類 (最も好適には、ジクロロメタン又はテトラヒドロフラン) である。

使用される活性化剤は、例えば、1H-テトラゾール、5-メチル-1H-テトラゾール、5-フェニル-1H-テトラゾールのようなテトラゾール類 (好適には、1H-テトラゾール) である。

使用される化合物 (XXX II) は、好適には、ジアリル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジメチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジエチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジ-tert-ブチル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジベンジル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイト、ジメチル N, N-ジエチルホスホロアミダイト、ジ-tert-ブチル N, N-エチルホスホロアミダイト、ジベンジル N, N-ジエチルホスホロアミダイト、N, N-ジエチル-1, 5-ジヒドロ-2, 4, 3-ベンゾジオキサホスフェピン-3-アミン、ビス (2-シアノエチル) N, N-ジイソプロピルホルホロアミダイト又はビス (9-フルオレニルメチル) N, N-ジイソプロピルホルホロアミダ

イトのようなホスホロアミダイト類であり、特に好適には、ジアリル N, N-ジイソプロピルホスホロアミダイトである。

反応温度は、原料化合物、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-10^{\circ}\text{C}$  乃至  $60^{\circ}\text{C}$ （好適には  $0^{\circ}\text{C}$  乃至  $30^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10 分間乃至 24 時間（好適に 30 分間乃至 2 時間）である。

上記反応で得られる亜リン酸エステル体は、反応の後処理及び単離をせずに、酸化剤と反応することができる。

酸化剤との反応において使用される不活性溶媒は、アルコール体（I'）と化合物（XXXII）との反応に使用されるものと同様のものである。

使用される酸化剤は、例えば、t-ブチルヒドロペルオキシド、クメンヒドロペルオキシド、m-クロロ過安息香酸、3, 5-ジニトロ過安息香酸、o-カルボキシ過安息香酸、ジメチルオキサラン、過酢酸、過トリフルオロ酢酸、過フタル酸、過酸化水素水のような過酸化物であり、好適には、t-ブチルヒドロペルオキシド又は m-クロロ過安息香酸である。

反応温度は、得られた亜リン酸エステル体、酸化剤、溶媒の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至室温（好適には、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $0^{\circ}\text{C}$ ）である。

反応時間は、得られた亜リン酸エステル体、酸化剤、溶媒、反応温度等により異なるが、通常、5 分間乃至 2 時間（好適には、5 分間乃至 30 分間）である。

リン酸基の保護基が、シアノ基、置換されてもよいシリル基、アリール基、ヘテロシクリル基、アリールチオ基、スルホニル基又はハロゲン原子により置換されても良い低級アルキル基である場合には、不活性溶媒中、水の存在下、酸で加水分解するか、あるいは、不活性溶媒中、ハロゲン化トリメチルシリル（例えば、プロモトリメチルシリル又はヨードトリメチルシリル）と反応させることにより該保護基が除去される。

上記加水分解に使用させる不活性溶媒は、例えば、メタノール、エタノー

ルのようなアルコール類;又はジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類であり、好適にはエーテル類であり、最も好適にはジオキサンである。

上記反応で使用される酸は、例えば、塩酸、硫酸、リン酸、硝酸のような無機酸であり、好適には塩酸である。

反応温度は、0℃乃至150℃（好適には20℃乃至100℃）であり、反応時間は、1時間乃至60時間（好適には1時間乃至48時間）である。

上記のハロゲン化トリメチルシリルとの反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類;アセトニトリルのようなニトリル類;或いは上記溶媒の混合溶媒であり、好適には、ハロゲン化炭化水素類又はニトリル類（より好適には、クロロホルム、ジクロロメタン又はアセトニトリル）である。

反応温度は、原料化合物、使用される溶媒の種類等によって異なるが、通常、-78℃乃至100℃（好適には0℃乃至80℃）である。

反応時間は、原料化合物、使用される溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分乃至24時間（好適には1時間乃至6時間）である。

リン酸基の保護基が低級アルケニル基である場合には、不活性溶媒中、アミン、蟻酸、蟻酸塩類、トリアルキルスズ化合物又は活性メチレン化合物の存在下、パラジウム化合物と反応させることにより、該保護基を除去することができる。

上記反応に使用される不活性溶媒は、例えば、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;トルエン、ベンゼン、キシレンのような芳香族炭化水素類;クロロホルム、ジクロロメタンのようなハロゲン化炭化水素類;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、n



ープロパノール、イソプロパノールのようなアルコール類；酢酸のような有機酸類；水；又は上記溶媒と水との混合溶媒であり、好適には、ニトリル類又はエーテル類（特に好適には、アセトニトリル又はテトラヒドロフラン）である。

上記反応で使用されるアミンは、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン（DABCO）のような第三級アミン類；ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピロリジンのような第二級アミン類；又はエチルアミン、プロピルアミン、ブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、N, N-ジエチルアニリンのような第一級アミン類であり、好適には、ピロリジンである。

上記反応で使用される蟻酸塩類は、好適には、蟻酸アンモニウム、蟻酸トリエチルアミン塩又は蟻酸n-ブチルアミン塩である。

上記反応に使用されるトリアルキルスズ化合物は、好適には、トリメチルスズ、トリエチルスズ又はトリブチルスズであり、特に好適には、トリブチルスズである。

上記反応で使用される活性メチレン化合物は、例えば、マロン酸メチル、マロン酸エチルのようなマロン酸エステル類；シアノ酢酸メチルのようなシアノ酢酸エステル類；アセト酢酸メチル、アセト酢酸エチル、ベンゾイル酢酸エチルのようなβ-ケト酢酸エステル類；アセチルアセトン、ベンゾイルアセトン、ジベンゾイルメタン、1, 3-シクロペンタジオン、1, 3-シクロヘキサジオン、ジメドンのような1, 3-ジケトン類；又は上記活性メチレン化合物のアルカリ金属塩であり、好適には、1, 3-ジケトン類又はマロン酸エステル類のナトリウム塩である。

上記反応で使用されるパラジウム化合物は、例えば、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム、ジアセトキシパラジウム、ジクロロジ（トリフェニルホスフィン）パラジウム、ビス（ジベンジリデンアセトン）パラジウムのようなパラジウム化合物であり、好適には、テトラキス（トリフェ

ニルホスフィン) パラジウムである。

反応温度は、原料化合物、使用される溶媒の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には20℃乃至80℃）である。

反応時間は、原料化合物、使用される溶媒、反応温度等により異なるが、通常、10分乃至48時間（好適に30分乃至24時間）である。

リン酸基の保護基が、アリールメチル基である場合は、前述の第A7工程における、前記アミノ基の保護基がアラルキル類又はアラルキルオキシカルボニル基である場合と同様に処理して除去される。

リン酸基の保護基が、アリール基である場合は、前述の第A7工程における、前記アミノ基の保護基が、低級脂肪族アシル類、芳香族アシル類、低級アルコキシカルボニル類又はシッフ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合と同様に処理して除去される。

リン酸基の保護基が、アミド類である場合、前述の第A7工程における、前記アミノ基の保護基が脂肪族アシル類、芳香族アシル類、アルコキシカルボニル類又はシッフ塩基を形成する置換されたメチレン基である場合の除去反応における酸処理と同様に行われる。

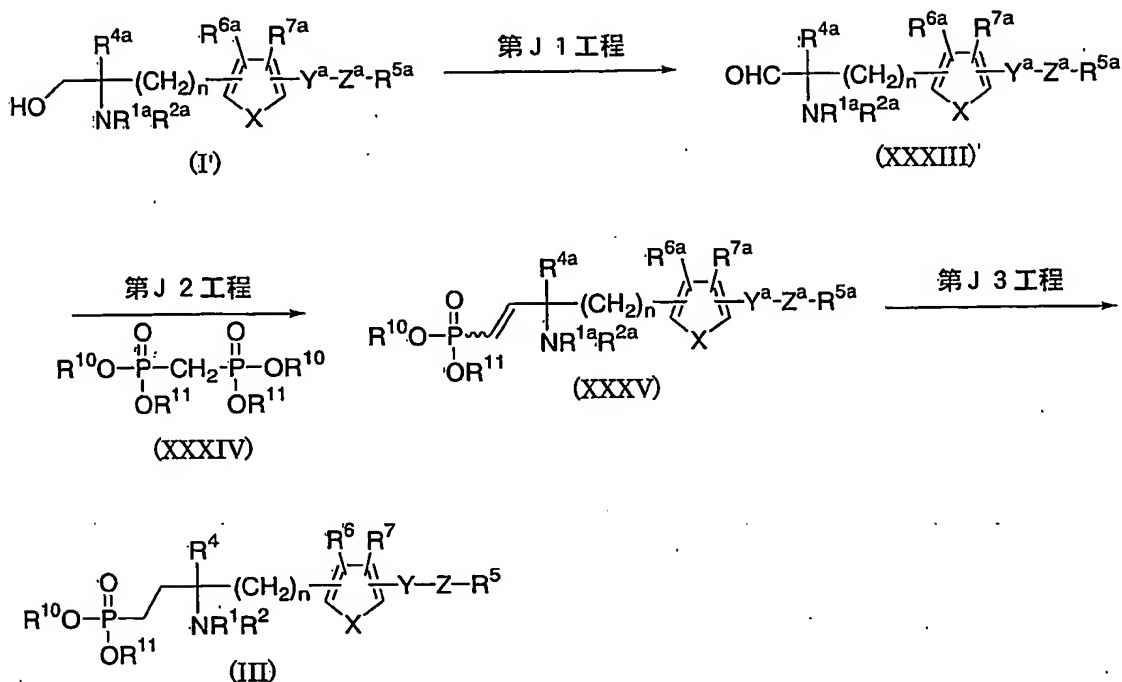
反応終了後、各反応の目的化合物は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、酸化剤が存在する場合は、適宜、還元剤で分解し、又は、不溶物が存在する場合には、適宜濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、分離、精製することができる。

#### (J法)

化合物(III)は、前述のA法乃至H法を適宜選択して製造されるが、

以下に示すJ法によっても、製造することができる。

# J 法



上記式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^{1a}$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^{2a}$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^{4a}$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{5a}$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{R}^{6a}$ 、 $\text{R}^7$ 、 $\text{R}^{7a}$ 、 $\text{R}^{10}$ 、 $\text{R}^{11}$ 、 $\text{Y}$ 、 $\text{Y}^a$ 、 $\text{Z}$ 、 $\text{Z}^a$ 及び $n$ は、前述したものと同意義を示す。

## 第 J 1 工程

第 J 1 工程は、一般式 (I') を有する化合物を酸化して、一般式 (XXXIII') を有するアルデヒド体を製造する工程である。

酸化反応は、一級アルコールからアルデヒドを生成する酸化反応であれば、特に限定はないが、例えば、ジクロロメタン中、ピリジン及びクロム酸を用いて行われる Collins 酸化；ジクロロメタン中、塩化クロム酸ピリジニウム (PCC) を用いて行われる PCC 酸化；ジクロロメタン中、ニクロム酸ピリジニウム (PDC) を用いて行われる PDC 酸化；ジクロロメタン中、親電子剤（例えば無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、塩化チオニル、塩化スルフリル、塩化

オキザリル、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジフェニルケテン・p-トリルイミン、N, N-ジエチルアミノアセチレン、三酸化硫黄・ピリジン錯体など) 及びジメチルスルホキシド(DMSO)を用いて行われる、Swern 酸化のような、DMSO 酸化; ジクロロメタン若しくはベンゼン中、二酸化マンガンを用いて行われる二酸化マンガン酸化; 又はジクロロメタン中、Dess-Martin ペルヨージナンを用いて行われる Dess-Martin 酸化であり、好適には、ジクロロメタン中で行われる、Dess-Martin 酸化、PDC 酸化又は Swern 酸化である。

反応温度は、原料化合物、溶剤、酸化剤の種類等によって異なるが、通常、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $100^{\circ}\text{C}$  であり、好適には、 $-78^{\circ}\text{C}$  乃至  $30^{\circ}\text{C}$  である。

反応時間は、原料化合物、溶媒、酸化剤の種類、反応温度等によって異なるが、通常 10 分間乃至 2 日間であり、好適には、30 分間乃至 24 時間である。

## 第 J 2 工程

第 J 2 工程は、不活性溶媒中、塩基の存在下、アルデヒド体 (XXX I I) を一般式 (XXX I V) を有する化合物と反応させ、 $\alpha$ ,  $\beta$ -不飽和リン酸エステル体 (XXX V) に導く工程である。

上記反応に使用される不活性溶媒は、出発物質をある程度溶解するものであれば、特に限定はないが、好適には、ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類; ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素のようなハロゲン化炭化水素類; ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、t-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類; アセトニトリル、イソブチロニトリルのようなニトリル類; ホルムアミドのようなアミド類; 又はジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類であり、さらに好適には、芳香族炭化水素類又はエーテル類 (特に好適には、ベンゼン又はテトラヒドロフラン) である。

使用される塩基は、化合物 (XXX I V) と反応させて、相当するカルバ

ニオンを生成させるものであれば、特に限定はないが、好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムのようなアルカリ金属炭酸水素塩類；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物類；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムメトキシド、カリウムエトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類；N-メチルモルホリン、トリエチルアミンのような有機アミン類；又はブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミドのような有機金属塩基類であり、さらに好適には、アルカリ金属アルコキシド類、アルカリ金属水素化物類及び有機金属塩基類であり、特に好適には、水素化ナトリウムである。

反応温度は、原料化合物、溶剤、ホスホニウム塩の種類、塩基の種類等によって異なるが、通常、 $-80^{\circ}\text{C}$ 乃至 $100^{\circ}\text{C}$ であり、好適には、 $-20^{\circ}\text{C}$ 乃至 $50^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、原料化合物、溶剤、ホスホニウム塩の種類、塩基の種類等によって異なるが、通常10分間乃至2日間であり、好適には、10分間乃至12時間である。

### 第J3工程

第J3工程は、一般式(I I I)を有する化合物を製造する工程であり、不飽和リン酸エステル化合物(X X X V)を不活性溶媒中、接触還元触媒の存在下、水素と反応させ、還元を行い、所望により、アミノ基の保護基を除去し、ヒドロキシの保護基を除去し、カルボキシル基の保護基を除去し、リン酸基の保護基を除去することにより行われる。

不飽和リン酸エステル化合物(X X X V)を水素と反応させる反応で 사용되는不活性溶媒は、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば、特に限定はないが、好適には、メタノール、エタノール、イソプロパノールのようなアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテ

ル、*t*-ブチルメチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；ヘキサン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類；又は酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類であり、さらに好適には、アルコール類（特に好適には、メタノール又はエタノール）である。

使用される接触還元触媒は、好適には、パラジウム-炭素、水酸化パラジウム-炭素、パラジウム黒、酸化白金、白金黒、ロジウム-酸化アルミニウム、トリフェニルホスフィン-塩化ロジウム(Wilkinson 錯体)、パラジウム-硫酸バリウム、ラネーニッケルであり、さらに好適には、パラジウム-炭素又はトリフェニルホスフィン-塩化ロジウム(Wilkinson 錯体)である。

水素の圧力は、特に限定はないが、通常1乃至10気圧で行われる。

反応温度は、原料化合物、溶剤、塩基の種類等によって異なるが、通常、0℃乃至100℃（好適には、0℃乃至50℃）である。

反応時間は、原料化合物、反応温度、溶剤、塩基の種類によって異なるが、通常、5分間乃至48時間（好適には、30分間乃至24時間）である。

反応終了後、各反応の目的化合物は常法に従って、反応混合物から採取される。例えば、反応混合物を適宜中和し、酸化剤が存在する場合は、適宜、還元剤で分解し、又は、不溶物が存在する場合には、適宜濾過により除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、目的化合物を含む有機層を分離し、水等で洗浄後、無水硫酸マグネシウム、無水硫酸ナトリウム、無水炭酸水素ナトリウム等で乾燥後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、クロマトグラフィー等の通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法を適宜組合せ、分離、精製することができる。

所望により行われる、アミノ基の保護基を除去する反応、ヒドロキシ基の保護基を除去する反応、カルボキシ基の保護基を除去する反応は、前述の第A7工程と同様にして行うことができ、リン酸基の保護基を除去する反応は、前述の第I1工程と同様に行うことができる。

本発明の一般式 (I) を有するアミノアルコール誘導体、一般式 (I I) を有するリン酸エステル又は一般式 (I I I) を有するホスホン酸誘導体、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルは、毒性が低く優れた免疫抑制作用を有し、本発明の一般式 (I)、(I I) 及び (I I I) を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する医薬組成物は、特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chron 病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener 肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture 症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、蕁瘡、Sydenham 舞蹈病、硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA 腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、さらに、真菌、マイコプラズマ、ウィルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞蹈病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患（特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リ

ウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患)の温血動物用(特に、ヒト用)の予防剤若しくは治療剤(好適には、治療薬)として有用である。

本発明の一般式(I)、(II)及び(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを、上記治療剤又は予防剤として使用する場合には、それ自体或は適宜の薬理学的に許容される、賦形剤、希釈剤等と混合し、例えば、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくはシロップ剤等による経口的又は注射剤若しくは坐剤等による非経口的に投与することができる。

これらの製剤は、賦形剤(例えば、乳糖、白糖、葡萄糖、マンニトール、ソルビトールのような糖誘導体; トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、 $\alpha$ 澱粉、デキストリンのような澱粉誘導体; 結晶セルロースのようなセルロース誘導体; アラビアゴム; デキストラン; プルランのような有機系賦形剤; 及び、軽質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、珪酸カルシウム、メタ珪酸アルミン酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体; 燐酸水素カルシウムのような燐酸塩; 炭酸カルシウムのような炭酸塩; 硫酸カルシウムのような硫酸塩等の無機系賦形剤を挙げることができる。)、滑沢剤(例えば、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩; タルク; コロイドシリカ; ビーガム、ゲイ蠟のようなワックス類; 硼酸; アジピン酸; 硫酸ナトリウムのような硫酸塩; グリコール; フマル酸; 安息香酸ナトリウム; DLロイシン; 脂肪酸ナトリウム塩; ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩; 無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類; 及び、上記澱粉誘導体を挙げることができる。)、結合剤(例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、マクロゴール、及び、前記賦形剤と同様の化合物を挙げることができる。)、崩壊剤(例えば、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボ



キシルメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシルメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体；カルボキシルメチルスターチ、カルボキシルメチルスターチナトリウム、架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾されたデンプン・セルロース類を挙げることができる。）、安定剤（メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類；クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類；塩化ベンザルコニウム；フェノール、クレゾールのようなフェノール類；チメロサール；デヒドロ酢酸；及び、ソルビン酸を挙げることができる。）、矯味矯臭剤（例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、香料等を挙げることができる。）、希釈剤等の添加剤を用いて周知の方法で製造される。

その使用量は症状、年齢等により異なるが、経口投与の場合には、1回当り1日下限0.05mg（好適には、5mg）、上限200mg（好適には、40mg）を、静脈内投与の場合には、1回当り1日下限0.01mg（好適には、1mg）、上限100mg（好適には、10mg）を成人に対して、1日当り1乃至6回症状に応じて投与することが望ましい。

## [発明を実施するための最良の形態]

以下に実施例、参考例、製剤例及び試験例を挙げて、本発明について更に具体的に詳述するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

## [実施例]

## (実施例 1)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-621)

(1 a) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (5 - ブロモフラン - 2 - イル) ブタン 0.3016 g (0.91 mmol)、5 - フェニルペント - 1 - イン 0.3974 g (2.76 mmol)、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) 63.0 mg (0.090 mmol) およびヨウ化銅 (I) 35.4 mg (0.19 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (9.0 ml) に懸濁し、トリエチルアミン 1.25 ml (9.0 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で 10 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加え、室温で 30 分間攪拌し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : 酢酸エチル / ヘキサン = 1 / 1) により精製して、標記化合物 0.2841 g (収率 79%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz), δ : 7.31-7.27 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 3H), 6.38 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.98 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.29 (d, J = 11.2 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.77 (t, 2H, J = 7.8 Hz), 2.64 (dt, 2H, J = 8.5 Hz, 17.0 Hz), 2.44 (t, 2H, J = 7.1 Hz), 2.30-2.22

(m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.01-1.88 (m, 6H), 1.35 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ): 3691, 3444, 2947, 1737, 1681, 1601, 1511, 1453, 1374, 1251, 1042, 812, 803。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$ : 396 ( $(M+H)^+$ )。

(1 b) (2 R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩

実施例 (1 a) で得られた (2 R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン 0.2710 g (0.69 mmol) をテトラヒドロフラン (1.4 ml) - メタノール (1.4 ml) の混合液に溶解し、水 (1.4 ml) および水酸化リチウム 1 水和物 0.2854 g (6.80 mmol) を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製して、粗製の (2 R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 0.2072 g を得た。得られた粗生成物をメタノールに溶解し、98%無水シュウ酸 59.2 mg (0.64 mmol) を加えて、室温で30分間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 0.2344 g (収率 91%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 3H), 6.40 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.77-2.65 (m, 4H), 2.41 (t, 2H,  $J = 7.0$  Hz), 2.07-1.83 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr): 3353, 3128, 2940, 1720, 1645, 1614, 1598, 1542, 1403, 1220, 1078, 789, 713, 700。

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 312((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 2)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルペン  
ト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示  
化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-570)

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2  
- メチル - 4 - (5 - ブロモフラン - 2 - イル) ブタンおよび 5 - シクロヘ  
キシルペント - 1 - インを出発原料とし、実施例 (1 a) および (1 b) に  
記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 68%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$  : 6.36 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 6.08  
(d, 1H, J = 3.1 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 3.49 (d, 1H, J = 11.5  
Hz), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.39 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.07-1.90 (m, 2H),  
1.76-1.54 (m, 7H), 1.35-1.12 (m, 9H), 0.96-0.86 (m, 2H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$  cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3362, 3124, 2923, 2850, 1720, 1611, 1597,  
1542, 1467, 1403, 1279, 1220, 1067, 967, 791, 721, 700。

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 318((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 3)

(2R) - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - シクロヘキシルオキシブ  
ト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示  
化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-842)

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2  
- メチル - 4 - (5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタンおよび 4 - シクロヘ  
キシルオキシブト - 1 - インを出発原料として、実施例 (1 a) および (1  
b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 66%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$  : 6.40 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.09  
(d, 1H, J = 3.3 Hz), 3.63 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.7 Hz),

3.50 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.39-3.32 (m, 1H), 2.77-2.62 (m, 4H), 2.07-1.89 (m, 4H), 1.77-1.73 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.36-1.23 (m, 8H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3360, 3099, 2932, 2857, 1719, 1614, 1597, 1542, 1403, 1219, 1106, 967, 785, 720, 711。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 320((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

#### (実施例 4)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 5 - [ 3 - ( 3, 4 - ジメチルフェニルオキシ ) プロパ - 1 - イニル ] フラン - 2 - イル } ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1836)

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - ブロモフラン - 2 - イル ) ブタンおよび 3 - ( 3, 4 - ジメチル ) フェニルオキシ - 1 - プロピンを出発原料として、実施例 (1a) および (1b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 46%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$  : 7.02 (d, 1H,  $J = 8.3$  Hz), 6.77 (d, 1H,  $J = 2.7$  Hz), 6.71 (dd, 1H,  $J = 8.3$  Hz, 2.7 Hz), 6.55 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 6.14 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 4.88 (s, 2H), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.49 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.07-1.90 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3358, 3134, 2921, 2582, 1720, 1649, 1616, 1579, 1542, 1499, 1370, 1286, 1250, 1223, 1166, 1122, 1046, 1025, 802, 712。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 328((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

#### (実施例 5)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 5 - フェニルペンタノイル ) フラン - 2 - イル ] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1093)

実施例(1b)で得られた(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 0.3440g (1.11mmol)をメタノール(3.5ml)に溶解し、6規定硫酸水溶液(3.5ml)を加えて4時間加熱還流した。冷却後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて中和し、さらに水および塩化メチレンを加えて30分攪拌後、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル(NHタイプ)クロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製した後、メタノールに溶解し、無水シュウ酸(98%)91.8mg(1.00mmol)を加えて、室温で30分間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて、析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄した後、減圧下乾燥して、標記化合物 0.3687g(収率90%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.31 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.17-7.12 (m, 3H), 6.36 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 3.61 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.52 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.89-2.76 (m, 4H), 2.64 (t, 2H,  $J = 7.2$  Hz), 2.13-1.95 (m, 2H), 1.75-1.63 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3108, 3027, 2981, 2935, 1718, 1698, 1661, 1604, 1542, 1516, 1202, 1093, 1082, 1047, 797, 700。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 330((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

#### (実施例6)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1' における 1-93)

(6a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン

10%パラジウム-炭素(50%含水)25mgをメタノール(1ml)

に懸濁し、実施例(1a)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン0.1245g(0.32mmol)をメタノール(1.5ml)に溶解した溶液を加え、水素雰囲気下、室温で8時間撹拌した。窒素置換後、反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過し、セライトを酢酸エチルで洗浄した。ろ液、洗液を合わせて減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=3/2)により精製して、標記化合物0.1029g(収率82%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.29-7.26 (m, 2H), 7.19-7.16 (m, 3H), 5.87 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.83 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.31 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 4.17 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 2.64-2.54 (m, 4H), 2.25-2.17 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.05-1.91 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.69-1.60 (m, 4H), 1.43-1.37 (m, 2H), 1.35 (s, 3H)。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 400( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

(6b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

実施例(6a)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン99.7mg(0.25mmol)をテトラヒドロフラン(0.5ml)およびメタノール(0.5ml)の混合液に溶解し、水(0.5ml)および水酸化リチウム1水和物0.1037g(2.47mmol)を加え、50℃で4時間撹拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル(NHタイプ)クロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製して、(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール74.6mg(収率95%)を得た。これをメタノール(2.3ml)に溶解し、無水シュウ酸(98%)

21. 1mg (0.23mmol)を加えて、室温で1時間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物78. 1mg (収率85%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.15-7.11 (m, 3H), 5.94 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 5.87 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.49 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.69-2.53 (m, 6H), 2.04-1.88 (m, 2H), 1.67-1.59 (m, 4H), 1.40-1.32 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3119, 3025, 2979, 2928, 2855, 1719, 1610, 1543, 1466, 1402, 1197, 1094, 1078, 1012, 786, 746, 721, 699。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 316 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例7)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-1433)

(7a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)フラン-2-イル]ブタン

参考例7で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-ヨードフラン-2-イル)ブタン0.2047g (0.51mmol)、2-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン0.2400g (0.76mmol)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)36.1mg (0.051mmol)および炭酸セシウム0.6738g (2.03mmol)をジメトキシエタン(4.0ml)および水(1ml)の混合液に懸濁し、80℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩化メチレン(5.



0 ml) に溶解し、トリエチルアミン 0.72 ml (5.2 mmol)、無水酢酸 0.24 ml (2.6 mmol) および 4-ジメチルアミノピリジン 6.4 mg (0.052 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。メタノール 0.10 ml (2.5 mmol) を加えて反応を止め、酢酸エチルおよび水を加えて、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2)により精製して、標記化合物 45.3 mg (収率 20%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.55-7.51 (m, 2H), 7.00-6.87 (m, 2H), 6.39 (d, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 6.06 (d, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.34 (d,  $J = 11.2$  Hz), 4.20 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 3.76 (d, 2H,  $J = 2.5$  Hz), 2.73-2.69 (m, 2H), 2.35-2.27 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.08-1.99 (m, 1H), 1.91 (s, 3H), 1.93-1.69 (m, 6H), 1.38 (s, 3H), 1.37-1.18 (m, 3H), 1.10-1.00 (m, 2H)。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 442 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ), 441 ( $\text{M}^{++}$ )。

(7b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

実施例 (7a) で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)フラン-2-イル]ブタン 44.0 mg (0.10 mmol) をテトラヒドロフラン (0.4 ml) およびメタノール (0.4 ml) の混合液に溶解し、水 (0.4 ml) および水酸化リチウム 1 水和物 43.6 mg (1.04 mmol) を加え、50℃で 4 時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NH タイプ) クロマトグラフィー(溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 50

／1)により精製して、生成物 35.2 mg (収率 99%)を得た。生成物をメタノール (2.0 ml) に溶解し、無水シュウ酸 (98%) 8.9 mg (0.10 mmol) を加えて、室温で 30 分間攪拌した。減圧下濃縮し、これにアセトンを加えて結晶析出をろ取し、アセトンで洗浄したのち減圧下乾燥して、標記化合物 28.2 mg (収率 66%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}-\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.55 (d, 2H,  $J = 8.7\text{Hz}$ ), 6.93 (d, 2H,  $J = 8.7\text{Hz}$ ), 7.16 (t, 1H,  $J = 2.0\text{Hz}$ ), 6.53 (d, 1H,  $J = 3.2\text{Hz}$ ), 6.17 (d, 1H,  $J = 3.2\text{Hz}$ ), 3.79 (d, 2H,  $J = 6.4\text{Hz}$ ), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.7\text{Hz}$ ), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.7\text{Hz}$ ), 3.28-3.27 (m, 2H), 2.09-1.69 (m, 8H), 1.38-1.04 (m, 8H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3387, 3235, 2924, 2852, 2578, 1618, 1568, 1499, 1466, 1448, 1390, 1288, 1245, 1174, 1024, 828, 783, 765。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 358 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

#### (実施例 8)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 5 - [ 3 - ( 2 - シクロヘキシルエトキシ) フェニル] フラン - 2 - イル } ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1444)

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - ヨードフラン - 2 - イル ) ブタンおよび 2 - [ 3 - ( 2 - シクロヘキシルエトキシ) フェニル ] - 4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロランを出発原料として、実施例 7 に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 21%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.27 (t, 1H,  $J = 8.0\text{Hz}$ ), 7.21 (dd, 1H,  $J = 8.0\text{Hz}$ ,  $2.0\text{Hz}$ ), 7.16 (t, 1H,  $J = 2.0\text{Hz}$ ), 6.80 (dd, 1H,  $J = 8.0\text{Hz}$ ,  $2.0\text{Hz}$ ), 6.69 (d, 1H,  $J = 3.5\text{Hz}$ ), 6.21 (d, 1H,  $J = 3.5\text{Hz}$ ), 4.04 (t, 2H,  $J = 6.6\text{Hz}$ ), 3.61 (d, 1H,  $J = 11.6\text{Hz}$ ), 3.52 (d, 1H,  $J = 11.6\text{Hz}$ ), 2.83-2.78 (m, 2H), 2.62-2.60 (m, 1H), 2.13-1.97 (m, 2H), 1.81-1.65

(m, 6H), 1.59-1.49 (m, 1H), 1.31-1.02 (m, 6H), 1.00-0.96 (m, 2H)。  
IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3213, 2925, 2850, 2571, 1720, 1701, 1614, 1600, 1578, 1563, 1548, 1449, 1300, 1216, 1205, 1052, 1033, 1017, 863, 772, 721, 689。  
マススペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 372 ((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 9)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペント - 1 - イニル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-621)

参考例 13 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチル - 5 - ヨードピロール - 2 - イル) ブタンおよび 5 - フェニルペント - 1 - インを出発原料として、実施例 (1a) および (1b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 57%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.14 (m, 5H), 6.16 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.80 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 3.63 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.57 (s, 3H), 3.54 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.77 (t, 2H,  $J = 7.6$  Hz), 2.66-2.61 (m, 2H), 2.43 (t, 2H,  $J = 7.0$  Hz), 2.04-1.96 (m, 1H), 1.92-1.84 (m, 3H), 1.33 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3212, 3026, 2935, 2897, 2571, 1719, 1700, 1611, 1521, 1496, 1454, 1405, 1279, 1218, 1053, 767, 721, 700。

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 325 ((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 10)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (4 - シクロヘキシルオキシブト - 1 - イニル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 1/2 シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-842)

参考例 13 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ -

2-メチル-4-(1-メチル-5-ヨードピロール-2-イル)ブタンおよび4-シクロヘキシルオキシブト-1-インを出発原料として、実施例(1 a)および(1 b)に記載の方法に準じて、標記化合物を得た(収率32%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.13 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.79 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 3.65 (t, 2H,  $J = 6.8$  Hz), 3.61 (d, 1H,  $J = 11.5$  Hz), 3.56 (s, 3H), 3.53 (d, 1H,  $J = 11.5$  Hz), 3.39-3.34 (m, 1H), 2.68-2.61 (m, 4H), 2.01-1.83 (m, 4H), 1.78-1.74 (m, 2H), 1.56-1.54 (m, 1H), 1.35-1.21 (m, 8H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3348, 2931, 2856, 1590, 1452, 1364, 1309, 1106, 762。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 333( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 11)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェニルオキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-833)

参考例 13 で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチル-5-ヨードピロール-2-イル)ブタンおよび3-(4-メチルフェニルオキシ)-1-プロピンを出発原料として、実施例(1 a)および(1 b)に記載の方法に準じて、標記化合物を得た(収率29%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.09 (d, 1H,  $J = 8.5$  Hz), 6.90 (d, 1H,  $J = 8.5$  Hz), 6.26 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.83 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.93 (s, 2H), 3.60 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.53 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.51 (s, 3H), 2.65-2.60 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.01-1.93 (m, 1H), 1.89-1.82 (m, 1H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3356, 2944, 2602, 2220, 1586, 1510, 1455, 1365, 1295, 1228, 1178, 1071, 1042, 1015, 815, 762。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 327((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 1 2)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 1 - メチル - 5 - [ 3 - ( 3, 4 - ジメチルフェニルオキシ) プロパ - 1 - イニル] ピロール - 2 - イル} ブタン - 1 - オール 1 / 2 シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 1a-2 における 1-1836)

参考例 1 3 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 1 - メチル - 5 - ヨードピロール - 2 - イル) ブタンおよび 3 - ( 3, 4 - ジメチルフェニルオキシ) - 1 - プロピンを出発原料として、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 33%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz), δ : 7.02 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 6.81 (d, 1H, J = 2.5 Hz), 6.73 (dd, 1H, J = 8.2 Hz, 2.5 Hz), 6.26 (d, 1H, J = 3.9 Hz), 5.83 (d, 1H, J = 3.9 Hz), 4.91 (s, 2H), 3.61 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.53 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.52 (s, 3H), 2.65-2.61 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.99-1.93 (m, 1H), 1.90-1.82 (m, 1H), 1.31 (s, 3H)。

IR スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3420, 2943, 2631, 2213, 1584, 1503, 1455, 1365, 1301, 1251, 1207, 1163, 1025, 806, 762。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 341((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 1 3)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - フェニルブト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 1a-1 における 1-559)

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - プロモフラン - 2 - イル) ブタンおよび 4 - フェニルブト - 1 - インを出発原料とし、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方

法に準じて、標記化合物を得た（収率 61 %）。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.29-7.17 (m, 5H), 6.35 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.07 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.87 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.77-2.64 (m, 4H), 2.06-1.89 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3353, 3140, 2924, 2896, 1724, 1651, 1617, 1598, 1542, 1403, 1221, 1075, 1054, 1010, 784, 713, 501。

マスペクトル ( $\text{ESI}^+$ ),  $m/z$  : 298 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### （実施例 14）

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- { 5 - [ 5 - (4-クロロフェニル) ペント-1-イニル] フラン-2-イル } ブタン-1-オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-628)

参考例 7 で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4- (5-ヨードフラン-2-イル) ブタンおよび 5- (4-クロロフェニル) ペント-1-インを出発原料とし、実施例 (1a) および (1b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た（収率 60 %）。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.25 (m, 2H), 7.20 (d, 1H,  $J = 8.3$  Hz), 6.40 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.51 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.78-2.65 (m, 4H), 2.42 (t, 2H,  $J = 6.8$  Hz), 2.08-1.83 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3257, 3105, 2936, 1718, 1598, 1540, 1493, 1405, 1280, 1202, 1093, 1015, 828, 792, 721, 701, 502。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 346 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### （実施例 15）

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- { 5 - [ 5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) ペント-1-イニル] フラン-2-イル } ブタン-1-オール

ール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-640)

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタンおよび 5 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) ペント - 1 - インを出発原料とし、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 58%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.51-7.48 (m, 4H), 6.41 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 6.10 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.51 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.85 (t, 2H,  $J = 7.4$  Hz), 2.78-2.66 (m, 2H), 2.44 (t, 2H,  $J = 7.0$  Hz), 2.08-1.87 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3358, 3139, 2935, 1722, 1651, 1615, 1597, 1542, 1403, 1326, 1222, 1168, 1119, 1073, 797, 721, 713, 703, 503。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 380 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 16)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 5 - [ 3 - (4 - メチルフェニルオキシ) プロプ - 1 - イニル ] フラン - 2 - イル } ブタン - 1 - オール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-833)

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (5 - ブロモフラン - 2 - イル) ブタンおよび 3 - (4 - メチルフェニルオキシ) - 1 - プロピンを出発原料とし、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 11%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.13-7.06 (m, 2H), 6.92-6.84 (m, 2H), 6.55 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.13 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 4.90 (s, 2H), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.34-3.28 (m, 2H), 2.80-2.64 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.07-1.87 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3352, 3138, 2921, 2893, 1727, 1653, 1616, 1596, 1544, 1511, 1373, 1224, 1018, 713。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 314 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

## (実施例 17)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 5 - [ 3 - ( 4 - メチルチオフェニルオキシ) プロプ - 1 - イニル] フラン - 2 - イル} ブタン - 1 - オール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-838)

参考例 6 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - プロモフラン - 2 - イル) ブタンおよび 3 - ( 4 - メチルチオフェニルオキシ) - 1 - プロピンを出発原料として、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 15%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.30-7.25 (m, 2H), 6.99-6.94 (m, 2H), 6.57 (d, 1H,  $J = 3.5$  Hz), 6.14 (d, 1H,  $J = 3.5$  Hz), 4.94 (s, 2H), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.80-2.65 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.08-1.88 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3359, 3136, 3089, 2920, 2230, 1722, 1646, 1618, 1594, 1542, 1493, 1373, 1279, 1230, 1073, 1039, 1015, 820, 797, 712。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 346 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

## (実施例 18)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 4 - フェニルオキシブト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-893)

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタンおよび 4 - フェニルオキシブト - 1 - インを出発原料として、実施例 (1 a) および (1 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 42%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.32-7.28 (m, 2H), 6.98-6.93 (m, 3H), 6.78 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 6.16 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 4.13 (t,



2H,  $J = 6.4$  Hz), 3.40 (dd, 2H,  $J = 19.8$  Hz, 11.4 Hz), 2.93 (t, 2H,  $J = 6.4$  Hz), 2.66 (t, 2H,  $J = 8.5$  Hz), 1.95-1.75 (m, 2H), 1.16 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3115, 2978, 2940, 1719, 1600, 1547, 1498, 1248, 1204, 1081, 1039, 752, 700。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 314 ( $(M+H)^+$ ; free 体)。

元素分析値 ( $\text{C}_{19}\text{H}_{23}\text{NO}_3 \cdot \text{C}_2\text{H}_2\text{O}_4$  として%),

計算値 : C : 62.52, H : 6.25, N : 3.47。

実測値 : C : 62.47, H : 6.14, N : 3.42。

#### (実施例 19)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルペン  
ト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 塩酸塩 (例示化合  
物番号 : 式 Ia-1 における 1-570)

(19a) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチ  
ル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルペン - 1 - イニル) フラン - 2 - イ  
ル] ブタン

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 -  
メチル - 4 - (5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタン 4.1685 g (1  
0.99 mmol)、5 - シクロヘキシルペン - 1 - イン 4.48 g (29.  
8 mmol)、ジクロロピス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II)  
0.7730 g (1.10 mmol) およびヨウ化銅 (I) 0.4205 g  
(2.21 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (110 ml) に懸  
濁し、トリエチルアミン 15.3 ml (110.1 mmol) を加え、窒素  
雰囲気下、60℃で2時間攪拌した。冷後、反応液に飽和塩化アンモニウム  
水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加え、室温で30分間攪  
拌し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、  
無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリ  
カゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : 酢酸エチル / ヘキサン = 3 / 2) によ

り精製して、標記化合物 2.6576 g (収率 60%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.36 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 5.97 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.29 (d,  $J = 11.0$  Hz), 4.17 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 2.63 (t, 2H,  $J = 8.1$  Hz), 2.40 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.29-2.21 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.00-1.93 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.72-1.51 (m, 7H), 1.35 (s, 3H), 1.33-1.08 (m, 6H), 0.93-0.84 (m, 2H)。マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 402 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(19b) (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩

実施例 (19a) で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン 1.2996 g (3.24 mmol) をテトラヒドロフラン (6.4 ml) - メタノール (6.4 ml) の混合液に溶解し、水 (6.4 ml) および水酸化リチウム 1水和物 1.3590 g (32.39 mmol) を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製して、粗製の (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 1.0048 g を得た。得られた粗生成物をメタノール (16 ml) に溶解し、4規定塩酸-ジオキサン溶液 0.79 ml (3.16 mmol) を加えて、室温で10分間攪拌した。減圧下濃縮し、エーテルを加えて析出した結晶をろ取し、エーテルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 1.0392 g (収率 91%) を得た。

融点 : 117-118℃。

旋光度,  $[\alpha]_D = +2.43$  ( $c = 1.00$ , MeOH)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.36 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 6.08 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.49 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.39 (t, 2H,  $J = 7.1$  Hz), 2.07-1.89 (m, 2H), 1.76-1.54 (m, 7H), 1.35-1.12 (m, 9H), 0.96-0.86 (m, 2H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3138, 2921, 2850, 2693, 2571, 1615, 1595, 1534, 1448, 1402, 1369, 1298, 1197, 1058, 788。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 318( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

(実施例 20)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - シクロヘキシルオキシブト - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 塩酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-842)

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタンおよび 4 - シクロヘキシルオキシブト - 1 - インを出発原料として、実施例 (19a) および (19b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 57%)。

融点 : 115-118°C。

旋光度,  $[\alpha]_D = +2.63$  ( $c = 1.00$ , MeOH)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.40 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 3.63 (t, 2H,  $J = 6.6$  Hz), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.39-3.32 (m, 1H), 2.76-2.62 (m, 4H), 2.07-1.87 (m, 4H), 1.78-1.73 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.35-1.19 (m, 8H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3204, 2931, 2858, 2667, 2570, 1611, 1597, 1537, 1450, 1390, 1364, 1199, 1107, 1067, 1032, 1002, 967, 952, 786。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 320( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

(実施例 21)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (4 - フェニルオキシブタ

ノイル) フラン-2-イル] ブタン-1-オール フマル酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-1 における 1-1199)

(21a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルオキシブタノイル) フラン-2-イル] ブタン

参考例(5b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(フラン-2-イル)ブタン 0.2589g (1.02mmol)、4-フェニルオキシブタン酸クロリド 0.2446g (1.23mmol)を塩化メチレン(9.0ml)に溶解し、窒素雰囲気下、-78℃にて塩化スズ(IV)のn-ヘプタン(1.0mmol/l)溶液2.05ml (2.05mmol)を5分間要して加え、同温度で2時間撹拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、液温を室温に戻したのち酢酸エチルを加えて希釈し、不溶物をろ別した。ろ液を酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=2/1~1/0)により精製して、標記化合物 0.1483g (収率35%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.13 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 7.00-6.87 (m, 3H), 6.18 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.42 (br s, 1H), 4.30 (d, J = 11.2 Hz), 4.15 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.04 (t, 2H, J = 6.0 Hz), 3.00 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.75-2.68 (m, 2H), 2.38-2.30 (m, 1H), 2.26-2.17 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.07-2.1.99 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z: 416((M+H)<sup>+</sup>)。

(21b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルオキシブタノイル) フラン-2-イル] ブタン-1-オール フマル酸塩

実施例(21a)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルア

ミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルオキシブタノイル)フラン-2-イル]ブタン0.2031g (0.49mmol) をテトラヒドロフラン (1.0ml) -メタノール (1.0ml) の混合液に溶解し、水 (1.0ml) および水酸化リチウム1水和物0.2065g (4.92mmol) を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製して、粗製の (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルオキシブタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 58.4mg を得た。得られた粗生成物をメタノール (1.7ml) に溶解し、フマル酸20.1mg (0.17mmol) を加えて、室温で30分間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 61.5mg (収率29%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz);  $\delta$  : 7.33 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 7.26-7.21 (m, 2H), 6.91-6.84 (m, 3H), 6.35 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.25 (s, 2H), 4.03 (t, 2H,  $J = 6.0$  Hz), 3.60 (d,  $J = 11.7$  Hz), 3.51 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.01 (t, 2H,  $J = 7.2$  Hz), 2.88-2.75 (m, 2H), 2.18-1.95 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3112, 3038, 2961, 1671, 1583, 1517, 1498, 1386, 1357, 1245, 1081, 1039, 869, 757, 719, 693。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 332 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

元素分析値 ( $\text{C}_{19}\text{H}_{25}\text{NO}_4 \cdot \text{C}_4\text{H}_4\text{O}_4$  として%),

計算値: C : 61.73, H : 6.53, N : 3.13。

実測値: C : 61.57, H : 6.40, N : 2.93。

(実施例 22)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 5 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニルオキシ) プロプ - 1 - イニル] フラン - 2 - イル } ブタン - 1 - オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1831)

(22a) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 3 - ヒドロキシプロプ - 1 - イニル) フラン - 2 - イル ] ブタン

参考例 7 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタン 1.5900 g (4.19 mmol)、3 - プロピン - 1 - オール 0.73 ml (12.54 mmol)、ジクロロピス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) 0.2940 g (0.42 mmol) およびヨウ化銅 (I) 0.161 g (0.85 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (42 ml) に懸濁し、トリエチルアミン 5.85 ml (42.9 mmol) を加え、窒素雰囲気下、60℃ で 2 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加え、室温で 30 分間攪拌し、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : 酢酸エチル / ヘキサン = 2 / 1 ~ 1 / 0) により精製して、標記化合物 1.0748 g (収率 83%) を得た。<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 6.50 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.01 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.50 (s, 2H), 4.29 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.16 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.70-2.60 (m, 2H), 2.32-2.24 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.03-1.95 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.77 (br s, 1H), 1.34 (s, 3H)。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 308 ((M+H)<sup>+</sup>)。

(22b) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - [ 5 - ( 3 - ブロモプロプ - 1 - イニル) フラン - 2 - イル ] ブタン

実施例 (22a) で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルア

ミノ-2-メチル-4-[5-(3-ヒドロキシプロプ-1-ニル)フラン-2-イル]ブタン 0.9515 g (3.10 mmol)、トリフェニルホスフィン 1.2375 g (3.73 mmol) を塩化メチレン (15 ml) に溶解し、氷冷下、四臭化炭素 1.0545 g (4.02 mmol) を加え、同温度で 30 分間攪拌した。反応液にメタノール 0.2 ml を加えて反応を止め、液温を室温に戻したのち減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒：塩化メチレン/アセトン=9/1)により精製して、標記化合物 0.9278 g (収率 82%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 6.54 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 6.02 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.18 (s, 2H), 4.16 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 2.69-2.60 (m, 2H), 2.32-2.24 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.02-1.95 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

(22c) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェニルオキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン

水素化ナトリウム (60% 含量) 40.0 mg (1.00 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (4 ml) に懸濁し、氷冷下、4-クロロフェノール 0.1302 g (1.01 mmol) を加え、その後室温で 30 分間攪拌した。この反応液に、氷冷下、実施例 (22b) で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(3-プロモプロプ-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン 0.3050 g (0.82 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (4 ml) に溶解した溶液を加え、その後室温で 30 分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加えて希釈し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒：塩化メチレン/アセトン=10/1)により精製して、標記化合物 0.3188 g (収率 93%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.25 (m, 2H), 6.96-6.92 (m, 2H), 6.52 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 6.01 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.29 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 4.15 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 2.67-2.59 (m, 2H), 2.31-2.24 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.02-1.94 (m, 1H), 1.93 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ) : 3444, 2225, 1738, 1681, 1511, 1491, 1450, 1373, 1286, 1249, 1173, 1093, 1039, 1014, 824。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 418 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(22d) (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- {5- [3- (4-クロロフェニルオキシ) プロプ-1-イニル] フラン-2-イル} ブタン-1-オール シュウ酸塩

実施例 (22c) で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4- {5- [3- (4-クロロフェニルオキシ) プロプ-1-イニル] フラン-2-イル} ブタン 0.3083 g (0.74 mmol) をテトラヒドロフラン (1.5 ml) - メタノール (1.5 ml) の混合液に溶解し、水 (1.5 ml) および水酸化リチウム 1 水和物 0.3096 g (7.38 mmol) を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒 : 塩化メチレン/メタノール = 50/1) により精製して、粗製の (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- {5- [3- (4-クロロフェニルオキシ) プロプ-1-イニル] フラン-2-イル} ブタン-1-オール 0.2156 g を得た。得られた粗生成物をメタノール (6.4 ml) に溶解し、98%無水シュウ酸 59.1 mg (0.64 mmol) を加えて、室温で30分間攪拌した。減圧下濃縮し、アセトンを加えて析出した結晶をろ取し、アセトンで洗浄後、減圧下乾燥して、標記化合物 0.2307 g (収率 75%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.30-7.26 (m, 2H), 7.01-6.97 (m,



2H), 6.57 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 6.14 (d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 4.96 (s, 2H), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.07-1.89 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3401, 3120, 2979, 2925, 2228, 1725, 1615, 1547, 1492, 1373, 1234, 1217, 1200, 1086, 1044, 1016, 830, 795, 698, 506。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 334((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

### (実施例 23)

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- {5- [3- (3-トリフルオロメチルフェニルオキシ) プロプ-1-イニル] フラン-2-イル} ブタン-1-オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1838)

実施例 (22b) で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル- [5- (3-ブロモプロプ-1-イニル) フラン-2-イル] ブタンおよび (3-トリフルオロメチル) フェノールを出発原料として、実施例 (22c) および (22d) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 76%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (DMSO-d<sub>6</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 7.60-7.55 (m, 1H), 7.36-7.53 (m, 3H), 6.77 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 6.21 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 5.21 (s, 2H), 3.43 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 3.37 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 2.67 (t, 2H,  $J = 8.6$  Hz), 1.91-1.76 (m, 2H), 1.15 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3126, 2980, 2220, 1719, 1614, 1593, 1546, 1455, 1328, 1207, 1167, 1130。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 368((M+H)<sup>+</sup>; free 体), 336。

### (実施例 24)

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- {5- [3- (3, 4-ジメトキシフェニルオキシ) プロプ-1-イニル] フラン-2-イル} ブタン-1-オール シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1842)

実施例(22b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[5-(3-プロモプロプ-1-イニル)フラン-2-イル]ブタンおよび3,4-ジメトキシフェノールを出発原料として、実施例(22c)および(22d)に記載の方法に準じて、標記化合物を得た(収率68%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.87 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 6.66 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 6.57-6.52 (m, 2H), 6.14 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 4.90 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.5$  Hz), 3.50 (d, 1H,  $J = 11.5$  Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.08-1.88 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。  
IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3393, 3093, 2969, 2224, 1722, 1598, 1537, 1513, 1467, 1452, 1278, 1260, 1228, 1194, 1157, 1135, 1021, 796, 721, 698。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 360 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 25)

(2R)-2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩  
(例示化合物番号 : 式 Ia-1 における 1-1660)

(25a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン

参考例18で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-エチル-4-(5-ヨードフラン-2-イル)ブタン79.1mg (0.357mmol)、4-シクロヘキシルオキシブト-1-イン168.2mg (1.10mmol)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)25.1mg (0.036mmol)およびヨウ化銅(I)13.8mg (0.072mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(3.6ml)に懸濁し、トリエチルアミン0.5ml (0.36mmol)を加え、

窒素雰囲気下 80℃で4時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加え室温で30分間攪拌し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1~1/2)により精製して、粗生成物 68.4 mg を得、分取用逆層 HPLC カラム [TSK-GEL ODS-80Ts (2.0 cm×25 cm)、東ソー社製、溶出溶媒:アセトニトリル/水=70/30] で精製して、標記化合物 46.5 mg (収率 31%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.38 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 5.96 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 5.27 (br s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.65 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.68 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.59 (t, 2H,  $J = 8.4$  Hz), 2.20-2.13 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.05-1.98 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.90 (m, 1H), 1.84-1.70 (m, 5H), 1.64 (m, 1H), 1.34-1.18 (m, 5H), 0.87 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 3307, 3078, 2934, 2858, 2220, 1744, 1658, 1540, 1452, 1369, 1237, 1103, 1042, 788, 756。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 418 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(25b) (2R)-2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール シュウ酸塩

実施例 (25a) で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタンをテトラヒドロフラン (0.5 ml) とメタノール (0.5 ml) と水 (0.5 ml) の混合液に溶解し、水酸化リチウム 1水和物 44.7 mg (1.07 mmol) を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を

留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール=1/0~50/1) により精製して、粗製の (2R)-2-アミノ-2-エチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル) フラン-2-イル] ブタン-1-オール 35.3 mg (収率 99%) を得た。得られた粗生成物をメタノールに溶解し、98% 無水シュウ酸 9.5 mg (0.106 mmol) を加えて、室温で 30 分間攪拌した。減圧下濃縮し、イソプロピルエーテルを加えて析出した結晶をろ取り、イソプロピルエーテルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 39.9 mg (収率 89%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル (DMSO- $d_6$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.56 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 6.16 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 4.19 (br s, 3H), 3.55 (t, 2H,  $J = 6.7$  Hz), 3.44 (s, 2H), 3.33-3.28 (m, 1H), 2.67-2.60 (m, 4H), 1.83-1.79 (m, 4H), 1.66-1.55 (m, 4H), 1.53-1.46 (m, 1H), 1.25-1.20 (m, 5H), 0.86 (t, 3H,  $J = 7.5$  Hz)。  
IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3402, 2931, 1918, 1611, 1542, 1198, 1106, 1089, 721, 700。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 356 ((M+Na) $^+$ ), 334 ((M+H) $^+$ ; free 体)。

#### (実施例 26)

リン酸 モノ (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル) フラン-2-イル] -1-ブチル エステル (例示化合物番号: 式 IIa-1 における 5-1072)

(26a) (2R)-2-アリルオキシカルボニルアミノ-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル) フラン-2-イル] ブタン-1-オール

実施例 20 で得られた (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチト-1-イニル) フラン-2-イル] ブタン-1-オール 0.5305 g (1.66 mmol) を酢酸エチル (16 ml) と水 (16 ml) に懸濁し、炭酸水素カリウム 0.1995 g (1.99 mmol)

mmol)を加え、ついでクロロギ酸アリル 0.21 ml (1.98 mmol)を加え、室温で30分間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えて希釈し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、標記化合物 0.6202 g (収率93%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.38 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.97 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.96-5.86 (m, 1H), 5.30 (ddd, 1H,  $J = 17.6$  Hz, 2.9 Hz, 1.5 Hz), 5.22 (dt, 1H,  $J = 9.5$  Hz, 1.5 Hz), 4.82 (br s, 1H), 4.52 (br d,  $J = 5.1$  Hz), 3.73-3.62 (m, 4H), 3.51 (br s, 1H), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.74-2.58 (m, 4H), 2.13 (ddd, 1H,  $J = 13.9$  Hz, 11.0 Hz, 5.1 Hz), 1.97-1.89 (m, 3H), 1.75-1.72 (m, 2H), 1.56-1.51 (m, 1H), 1.34-1.18 (m, 8H)。

(26b) リン酸 (2R)-2-アリルオキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル ジアリル エステル

実施例(26a)で得られた(2R)-2-アリルオキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 0.6202 g (1.54 mmol)を塩化メチレン(15 ml)に溶解し、氷冷下、1H-テトラゾール 0.7220 g (10.31 mmol)およびジアリル ジイソプロピルホスホロアミダイト 0.81 ml (3.06 mmol)を加え、その後室温で2時間攪拌した。反応液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸(70%含量) 0.7556 g (3.07 mmol)を加え、同温度で10分間攪拌した。反応液に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製して、標記化合物 0.7049 g (収率81%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.37 (d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.99-5.85 (m, 3H), 5.40-5.19 (m, 6H), 4.87 (br s, 1H), 4.16 (dd, 1H,  $J = 10.3$  Hz, 5.9 Hz), 4.03 (dd, 1H,  $J = 10.3$  Hz, 5.9 Hz), 3.65 (d, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.70-2.59 (m, 4H), 2.22-2.14 (m, 1H), 1.96-1.88 (m, 3H), 1.75-1.72 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.34-1.22 (m, 8H)。

マススペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 563 ( $\text{M}^+$ )。

(26c) リン酸 モノ (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル

実施例 (26b) で得られたリン酸 (2R)-2-アリルオキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル ジアリル エステル 0.7037 g (1.25 mmol)、トリフェニルホスフィン 69.0 mg (0.26 mmol) およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (0) 75.8 mg (0.066 mmol) をアセトニトリル (13 ml) に懸濁し、窒素雰囲気下、ピロリジン 0.66 ml (7.91 mmol) を加え、室温で 15 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に 50% 含水エタノール (40 ml) を加えて希釈したのち、酢酸を加えて pH 4 として結晶を析出させた。析出結晶をろ取り、水およびエタノールで洗浄して粗結晶を得た。粗結晶をメタノール (300 ml) と水 (60 ml) の混合液に加熱溶解し、活性炭を加えてろ過し、減圧下濃縮したのちエタノールを加えて析出結晶をろ取り、エタノールで洗浄後乾燥して、標記化合物 0.2672 g (収率 54%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{CO}_2\text{D}$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.42 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.10 (d, 2H,  $J = 10.3$  Hz), 3.70 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 3.43-3.37 (m, 1H), 2.83-2.72 (m, 2H), 2.69 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.18-2.06 (m, 2H), 1.94 (br d, 2H,  $J = 10.3$  Hz), 1.76-1.73 (m, 2H), 1.56-1.52 (m, 1H), 1.40 (s, 3H), 1.38-1.18 (m, 5H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3413, 2931, 2857, 1645, 1566, 1540, 1469, 1449, 1212, 1184, 1102, 1067, 1043, 949, 796, 511.

マスペクトル (ESI<sup>-</sup>),  $m/z$  : 398 ((M-H)<sup>-</sup>).

(実施例 27)

リン酸 モノ (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] - 1 - ブチル エステル (例示化合物番号 : 式 IIa-1 における 5-824)

実施例 2 で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - シクロヘキシルペント - 1 - イニル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール シュウ酸塩を出発原料とし、実施例 (26a)、(26b) および (26c) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 24%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>D, 400MHz),  $\delta$  : 6.39 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 6.07 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 4.10 (d, 2H,  $J = 10.3 \text{ Hz}$ ), 2.79-2.75 (m, 2H), 2.40 (t, 2H,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ), 2.17-2.05 (m, 2H), 1.75-1.44 (m, 7H), 1.41 (s, 3H), 1.35-1.12 (m, 6H), 0.95-0.90 (m, 2H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3233, 2922, 2850, 2559, 1642, 1594, 1537, 1448, 1256, 1184, 1078, 1029, 942, 825, 794, 572, 514.

マスペクトル (FAB<sup>-</sup>),  $m/z$  : 396 ((M-H)<sup>-</sup>).

(実施例 28)

リン酸 モノ (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - {5 - [3 - (3, 4 - ジメチルフェニルオキシ) プロプ - 1 - イニル] フラン - 2 - イル} - 1 - ブチル エステル (例示化合物番号 : 式 IIa-1 における 5-2278)

実施例 4 で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - {5 - [3 - (3, 4 - ジメチルフェニルオキシ) プロプ - 1 - イニル] フラン - 2 - イル} ブタン - 1 - オール シュウ酸塩を出発原料とし、実施例 (26a)、(26b) および (26c) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収

率 21%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{CO}_2\text{D}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.02 (d, 1H,  $J = 8.1$  Hz), 6.78 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 6.73 (dd, 1H,  $J = 8.1$  Hz, 3.0 Hz), 6.56 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.13 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.90 (s, 2H), 4.10 (d, 2H,  $J = 10.3$  Hz), 2.84-2.72 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.15-2.05 (m, 2H), 1.40 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3411, 2922, 2227, 1616, 1536, 1501, 1451, 1371, 1286, 1250, 1202, 1185, 1166, 1045, 1028, 931, 799, 573, 514。

マスマスペクトル (FAB $^-$ ),  $m/z$  : 406 ( $(\text{M}-\text{H})^-$ )。

#### (実施例 29)

(3R) - 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸 (例示化合物番号 : 式 IIIa-1 における 5-1344)

(29a) (2R) - 2 - *t* - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール

実施例 5 で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 97.8 mg (0.30 mmol) を塩化メチレン (3 ml) に溶解し、ジ-*t*-ブチルジカルボナート 77.3 mg (0.35 mmol) およびトリエチルアミン 85  $\mu\text{l}$  (0.61 mmol) を加え、室温で 19 時間攪拌した。減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : ヘキサン / 酢酸エチル = 1 / 1) により精製して、標記化合物 112.2 mg (収率 88%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.29-7.23 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.08 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.18 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.63 (br s, 1H),



4.03 (br s, 1H), 3.66 (d, 2H,  $J = 5.9$  Hz), 2.84-2.68 (m, 4H), 2.65 (t, 2H,  $J = 8.1$  Hz), 2.18 (ddd, 1H,  $J = 16.6$  Hz, 11.0 Hz, 5.1 Hz), 1.98 (ddd, 1H,  $J = 16.6$  Hz, 11.7 Hz, 5.1 Hz), 1.81-1.65 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.19 (s, 3H)。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 430 ( $(M+H)^+$ )。

(29b) (2R) - 2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)フラン-2-イル]-1-ブタナール

実施例(29a)で得られた(2R) - 2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール 110.2 mg (0.26 mmol) を塩化メチレン (2.6 ml) に溶解し、Dess-Martin 試薬 165.0 mg (2.28 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で1時間攪拌した。減圧下濃縮し、反応液に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて過剰の試薬を分解したのち、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和重曹水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/1)により精製して、標記化合物 105.9 mg (収率97%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 9.34 (s, 1H), 7.29-7.25 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.06 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 6.16 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 5.16 (br s, 1H), 2.77 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.74-2.56 (m, 4H), 2.40-2.36 (m, 1H), 2.22-2.14 (m, 1H), 1.80-1.65 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.37 (s, 3H)。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 428 ( $(M+H)^+$ )。

(29c) ジエチル (3R) - 3-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)フラン-2-イル]ペント-1-エニルホスホン酸 エステル

水素化ナトリウム (60%含量) 16.0 mg (0.40 mmol) をテ

トラヒドロフラン (1 ml) に懸濁し、氷冷下、テトラエチル メチレンジホスホナート 0.100 ml (0.40 mmol) を5分間要して加え、その後室温にて1時間攪拌した。反応液に実施例 (29b) で得られたジエチル (2R) - 2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル) フラン-2-イル]-1-ブタナール 104.5 mg (0.24 mmol) をテトラヒドロフラン (4 ml) に溶解した溶液を氷冷下、5分間要して加え、同温度にて15分間攪拌した。反応液に酢酸 22  $\mu$ l (0.38 mmol) を加えて中和したのち減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル) により精製して、標記化合物 129.0 mg (収率 94%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$ : 7.29-7.24 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.07 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.75 (dd, 1H,  $J = 22.7$  Hz, 17.6 Hz), 6.16 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.71 (t, 1H,  $J = 17.6$  Hz), 4.60 (br s, 1H), 4.15-4.04 (m, 4H), 2.77 (t, 2H,  $J = 8.1$  Hz), 2.74-2.63 (m, 4H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.09-2.01 (m, 1H), 1.81-1.65 (m, 4H), 1.42 (s, 9H), 1.40 (s, 3H), 1.33 (t, 6H,  $J = 7.3$  Hz)。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 562 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(29d) ジエチル (3R) - 3-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸 エステル

実施例 (29c) で得られたジエチル (3R) - 3-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル) フラン-2-イル]ペント-1-エニルホスホン酸 エステル 127.8 mg (0.23 mmol) をエタノール (2.3 ml) に溶解し、塩化トリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I) 22.0 mg (0.024 mmol) を加え、水素雰囲気下、50℃で8時間攪拌した。冷後、反応液に塩化トリス

(トリフェニルホスフィン) ロジウム (I) 21.5 mg (0.023 mmol) を追加し、水素雰囲気下、50℃で8時間攪拌した。反応液を減圧下留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル)により精製して、粗生成物 142.1 mg を得、分取用逆層 HPLC カラム [Inertsil ODS-3 (2.0 cm × 25 cm)、GLサイエンス社製、溶出溶媒: アセトニトリル/水 = 75/25、流速: 10 ml/min] で精製して、標記化合物 109.5 mg (収率 85%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.07 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.15 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.36 (br s, 1H), 4.15-4.10 (m, 4H), 2.77 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.72-2.63 (m, 4H), 2.22-2.17 (m, 2H), 1.92-1.85 (m, 1H), 1.80-1.63 (m, 7H), 1.42 (s, 9H), 1.33 (t, 6H, J = 7.3 Hz), 1.19 (s, 3H)。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 564 ((M+H)<sup>+</sup>)。

(29e) (3R) - 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

実施例 (29d) で得られたジエチル (3R) - 3 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸 エステル 108.2 mg (0.19 mmol) を塩化メチレン (1.9 ml) に溶解し、臭化トリメチルシラン 0.255 ml (1.93 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で4時間攪拌した。減圧下溶媒を留去したのち、残渣に含水エタノールを加えて希釈し、これにアンモニア水溶液および酢酸を加えて pH 4 として結晶を析出させた。析出結晶をろ取し、水およびエタノールで洗浄後乾燥して、標記化合物 51.4 mg (収率 66%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>D, 400MHz), δ : 7.29 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 7.26-7.23 (m, 2H), 7.18-7.12 (m, 3H), 6.35 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 2.85 (t, 4H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.23-1.92 (m, 6H), 1.78-1.64 (m, 4H), 1.44 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3160, 2934, 2860, 2560, 2529, 1670, 1552, 1516, 1453, 1391, 1314, 1140, 1068, 1046, 913, 882, 804, 723, 700, 568, 525, 490, 468.

マスペクトル (FAB<sup>-</sup>),  $m/z$  : 406 ((M-H)<sup>-</sup>).

(実施例 30)

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-559)

参考例 13 で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチル-5-ヨードピロール-2-イル)ブタンおよび 4-フェニルブト-1-インを出発原料として、実施例 (1a) および (1b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 58%)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$  : 7.30-7.26 (m, 4H), 7.21-7.16 (m, 1H), 6.09 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 5.76 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 3.59 (d, 1H,  $J = 11.7 \text{ Hz}$ ), 3.52 (d, 1H,  $J = 11.7 \text{ Hz}$ ), 3.41 (s, 3H), 2.88 (t, 2H,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ), 2.73 (t, 2H,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ), 2.62-2.58 (m, 2H), 1.98-1.80 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr) : 3362, 3026, 2943, 2224, 2080, 1591, 1496, 1454, 1300, 1073.

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 311 ((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 31)

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-93)

(31a) (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール

# − 2 − イル] ブタン

参考例 13 で得られた (2R) − 1 − アセトキシ − 2 − アセチルアミノ − 2 − メチル − 4 − (1 − メチル − 5 − ヨードピロール − 2 − イル) ブタン 0.2918 g (0.74 mmol)、5 − フェニルペンター 1 − イン 0.3225 g (2.24 mmol)、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) 52.3 mg (0.075 mmol) およびヨウ化銅 (I) 29.0 mg (0.15 mmol) を N, N − ジメチルホルムアミド (7.4 ml) に懸濁し、トリエチルアミン 1.04 ml (7.5 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で 1 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、水および酢酸エチルを加え、室温で 30 分間攪拌し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2) により精製して、標記化合物 0.2205 g (収率 73%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 7.31-7.27 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 3H), 6.26 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.81 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.35 (br s, 1H), 4.32 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 3.55 (s, 3H), 2.78 (t, 2H, J = 7.7 Hz), 2.55 (t, 2H, J = 8.2 Hz), 2.46 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.27-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.84 (m, 6H), 1.37 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>) : 3443, 2944, 2861, 1736, 1679, 1603, 1512, 1454, 1374, 1251, 1042。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 409 ((M+H)<sup>+</sup>), 408 (M<sup>+</sup>)。

(31b) (2R) − 1 − アセトキシ − 2 − アセチルアミノ − 2 − メチル − 4 − [1 − メチル − 5 − (5 − フェニルペンチル) ピロール − 2 − イル] ブタン

実施例 (31a) で得られた (2R) − 1 − アセトキシ − 2 − アセチルアミノ − 2 − メチル − 4 − [1 − メチル − 5 − (5 − フェニルペンター 1 − イニル) ピロール − 2 − イル] ブタン 77 mg (0.19 mmol) をメタノ

ール (2 ml) に溶解し、10%パラジウム-炭素 (50%含水) 4.3 mgを加え、水素雰囲気下、室温で1時間攪拌した。窒素置換後、反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過し、セライトを酢酸エチルで洗浄した。ろ液、洗液を合わせて減圧下濃縮乾固して、標記化合物 75.5 mg (収率 97%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.25 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 3H), 5.79 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.77 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.36, (br s, 1H), 4.32 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 4.19 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 3.37 (s, 3H), 2.61 (t, 2H,  $J = 7.7$  Hz), 2.55-2.47 (m, 4H), 2.23-2.15 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.94-1.87 (m, 1H), 1.90 (s, 3H), 1.70-1.59 (m, 4H), 1.53 (s, 3H), 1.47-1.39 (m, 2H)。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 412 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(31c) (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩

実施例 (31b) で得られた (2R) - 1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブタン 75.0 mg (0.18 mmol) をテトラヒドロフラン (1 ml) およびメタノール (1 ml) の混合液に溶解し、水 (1 ml) および水酸化リチウム 1水和物 76 mg (1.81 mmol) を加え、50℃で6時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 1/0 ~ 50/1) により精製して、(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 53.6 mg (収率 90%)を得た。得られた (2R) - 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンチル)ピロール-2-イル]ブ

タン-1-オール 53.6 mg をメタノール (1.6 ml) に溶解し、無水シュウ酸 (98%) 7.4 mg (0.082 mmol) を加えて、室温で1時間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 49.2 mg (収率 81%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.16-7.11 (m, 3H), 5.71 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.66 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 3.60 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.52 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.41 (s, 3H), 2.65-2.56 (m, 4H), 2.53-2.49 (m, 2H), 1.99-1.81 (m, 2H), 1.68-1.56 (m, 4H), 1.44-1.37 (m, 2H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3315, 2930, 2092, 1632, 1591, 1549, 1455, 1304, 1073。

マスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 329 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

### (実施例 32)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-31)

参考例 13 で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチル-5-ヨードピロール-2-イル)ブタンおよび 4-フェニルブト-1-インを出発原料として、実施例 (31a)、(31b) および (31c) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 28%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.16-7.11 (m, 3H), 5.71 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 5.66 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 3.60 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.53 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.39 (s, 3H), 2.66-2.53 (m, 6H), 1.98-1.81 (m, 2H), 1.72-1.55 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3347, 3024, 2933, 2858, 1589, 1454, 1299,

1072, 763, 745, 698.

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$ : 315((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 33)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-1093)

(33a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-{1-メチル-[5-フェニル-1-(5-フェニルペンタノイルオキシ)ペント-1-エニル]ピロール-2-イル}ブタン

参考例(19b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチルピロール-2-イル)ブタン 4.23 g (15.4 mmol) をトルエン(100 ml)に溶解し、4-ジメチルアミノピリジン 9.41 g (77.0 mmol) および 5-フェニル吉草酸クロリド(98%) 7.92 g (39.5 mmol) をトルエン(50 ml)に溶解した溶液を加え、110℃で48時間攪拌した。室温に戻し、反応液に酢酸エチルおよび水を加えて酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=3/2~2/1)により精製して、標記化合物 4.03 g (収率 45%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$ : 7.26-7.23 (m, 4H), 7.17-7.11 (m, 6H), 6.96 (d, 1H, J = 4.2 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 4.2 Hz), 5.41 (br s, 1H), 4.31 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.15 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.11 (t, 1H, J = 8.1 Hz), 3.83 (s, 3H), 2.67-2.39 (m, 8H), 2.34-2.26 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.04-1.86 (m, 6H), 1.61-1.48 (m, 6H), 1.36 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$  cm<sup>-1</sup> (CHCl<sub>3</sub>): 3443, 2938, 2861, 1733, 1681, 1634, 1487, 1454, 1374, 1249, 1044, 。



マススペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$ : 587((M+H)<sup>+</sup>)。

(33b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩

実施例(33a)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-{1-メチル-[5-フェニル-1-(5-フェニルペンタノイルオキシ)ペント-1-エニル]ピロール-2-イル}ブタン 4.0270g (6.86mmol)をテトラヒドロフラン(14ml)とメタノール(14ml)との混合液に溶解し、水(14ml)および水酸化リチウム1水和物2.8820g (68.68mmol)を加え、50℃で4時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル(NHタイプ)クロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製して、粗製の(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール2.1152gを得た。得られた粗生成物をメタノール(31ml)に溶解し、4規定塩酸-ジオキサン溶液1.54ml (6.16mmol)を加えて、室温で10分間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチルを加えて析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物2.0685g(収率79%)を得た。

融点: 130-131℃。

旋光度,  $[\alpha]_D = -4.81$  ( $c = 1.00$ , MeOH)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz),  $\delta$ : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 7.05 (d, 1H,  $J = 4.2$  Hz), 6.03 (d, 1H,  $J = 4.2$  Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H,  $J = 11.4$  Hz), 3.55 (d, 1H,  $J = 11.4$  Hz), 2.78-2.67 (m, 4H), 2.63 (t, 2H,  $J = 7.2$  Hz), 2.02 (ddd, 1H,  $J = 13.8$  Hz, 9.4 Hz, 7.6 Hz), 1.90 (ddd, 1H,  $J = 13.8$  Hz, 11.5 Hz, 6.3 Hz), 1.70-1.64 (m, 4H), 1.34

(s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3215, 2937, 2883, 2691, 2571, 1646, 1525, 1482, 1457, 1380, 1294, 1228, 1182, 1055, 998, 913, 770, 751, 700。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 343 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

元素分析値 ( $\text{C}_{21}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_2 \cdot \text{HCl}$  として%),

計算値 : C : 66.56, H : 8.25, N : 7.39, Cl : 9.36。

実測値 : C : 66.51, H : 8.20, N : 7.47, Cl : 9.08。

#### (実施例 3.4)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - { 1 - メチル - 5 - [ 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ペンタノイル ] ピロール - 2 - イル } ブタン - 1 - オール 塩酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-1094)

参考例 (19b) で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - ( 1 - メチルピロール - 2 - イル ) ブタンおよび 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) 吉草酸クロリドを出発原料として、実施例 (33a) および (33b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 42%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.20-7.13 (m, 2H), 7.05 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 6.99-6.92 (m, 2H), 6.03 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H,  $J = 11.4$  Hz), 3.55 (d, 1H,  $J = 11.4$  Hz), 2.76 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.74-2.66 (m, 2H), 2.62 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.08-1.86 (m, 2H), 1.73-1.60 (m, 4H), 1.35 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3352, 3210, 3153, 3035, 2930, 2863, 1634, 1601, 1509, 1480, 1464, 1371, 1349, 1222, 1175, 1067, 823, 766。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 361 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 35)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [ 1 - メチル - 5 - ( 4 - フェニ

ルブタノイル) ピロール-2-イル] ブタン-1-オール 塩酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-1082)

参考例(19b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチルピロール-2-イル)ブタンおよび4-フェニル酪酸クロリドを出発原料として、実施例(33a)および(33b)に記載の方法に準じて、標記化合物を得た(収率48%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.12 (m, 5H), 6.97 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 6.02 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.55 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.78-2.62 (m, 6H), 2.08-1.85 (m, 4H), 1.35 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3203, 3025, 2941, 2572, 2029, 1649, 1518, 1482, 1457, 1382, 1297, 1179, 1140, 1057, 989, 915, 752, 699。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 329 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

### (実施例36)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(3-フェニルプロパノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩(例示化合物番号: 式 Ia-2 における 1-1080)

参考例(19b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-メチルピロール-2-イル)ブタンおよび3-フェニルプロピオン酸クロリドを出発原料として、実施例(33a)および(33b)に記載の方法に準じて、標記化合物を得た(収率42%)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.27-7.11 (m, 5H), 7.03 (d, 1H,  $J = 4.4$  Hz), 6.01 (d, 1H,  $J = 4.4$  Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.55 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.09-3.02 (m, 2H), 2.99-2.92 (m, 2H), 2.76-2.62 (m, 2H), 2.08-1.85 (m, 2H), 1.34 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3376, 3026, 2932, 2559, 1640, 1605, 1484, 1455, 1410, 1381, 1294, 1225, 1135, 1069, 983, 924, 770, 747, 699。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 315((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 3 7)

(2 R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - シクロヘキシルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 塩酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-1083)

参考例 (1 9 b) で得られた (2 R) - 1 - アセトキシー - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタンおよび 5 - シクロヘキシル吉草酸クロリドを出発原料として、実施例 (3 3 a) および (3 3 b) に記載の方法に準じて、標記化合物を得た (収率 2 9 %)。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CD<sub>3</sub>OD, 400MHz), δ : 7.05 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 6.04 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 3.87 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.78-2.64 (m, 4H), 2.09-1.86 (m, 2H), 1.76-1.58 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 11H), 0.95-0.80 (m, 2H)。

IR スペクトル, ν<sub>max</sub> cm<sup>-1</sup> (KBr) : 3354, 3212, 3156, 3034, 2921, 2850, 1637, 1498, 1480, 1464, 1379, 1370, 1292, 1224, 1175, 1066, 1054, 914, 762。

マスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 349((M+H)<sup>+</sup>; free 体)。

(実施例 3 8)

(2 R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 4 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 1 / 2 シュウ酸塩 (例示化合物番号 : 式 Ib-2 における 2-252)

(3 8 a) (4 R) - 4 - メチル - 4 - { 2 - [1 - メチル - 4 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] エチル } - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 1 1 で得られた (4 R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 1 0 0 mg (0. 4 8 mmol) をベンゼン (4 ml) に溶解し、N, N - ジメチル

ー5ーフェニルペンタナミド99mg (0.48mmol) およびオキシ三塩化リン43 $\mu$ l (0.46mmol)を加え、6時間加熱還流した。反応液に20%酢酸ナトリウム水溶液2mlを加えて80℃で15分間攪拌した。室温に戻し、水を加えて酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=1/1~3/2~4/1)により精製して、標記化合物11mg (収率6%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 500MHz),  $\delta$  : 7.30-7.24 (m, 2H), 7.20-7.15 (m, 4H), 6.31 (s, 1H), 5.72 (br s, 1H), 4.17 (d, 1H,  $J = 8.6$  Hz), 4.10 (d, 1H,  $J = 8.6$  Hz), 3.57 (s, 3H), 2.70-2.55 (m, 6H), 1.94 (t, 2H,  $J = 8.2$  Hz), 1.78-1.60 (m, 4H), 1.43 (s, 3H)。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 369 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(38b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-4-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩

実施例(38a)で得られた(4R)-4-メチル-4-{2-[1-メチル-4-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]エチル}-1,3-オキサゾリジン-2-オン11mg (0.03mmol)をテトラヒドロフラン(1ml)-メタノール(1ml)の混合液に溶解し、5規定水酸化カリウム水溶液(1ml)を加え、2日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-4-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール9mgを得た。得られた粗生成物6.5mgをメタノール(0.5ml)に溶解し、無水シュウ酸(98%含量)0.85mg (0.0095mmol)を加えて、室温で10分間攪拌した。減圧下濃縮乾固して、標記化合物7.0mg (収率84%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 500MHz),  $\delta$  : 7.42 (s, 1H), 7.26-7.20 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 6.32 (s, 1H), 3.65-3.60 (m, 4H), 3.57 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.74-2.60 (m, 6H), 2.04-1.86 (m, 2H), 1.73-1.62 (m, 4H), 1.33 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}} \cdot \text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3339, 3025, 2929, 2859, 2565, 1611, 1525, 1497, 1453, 1438, 1355, 1310, 1176, 1069, 928, 818, 774, 749, 700。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 343 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

### (実施例 39)

(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニル - 1 - ヒドロキシペンチル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 1 / 2 シュウ塩 (例示化合物番号 : 式 Ia-2 における 1-1399)

実施例 (33b) で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 塩酸塩 185 mg (0.49 mmol) を塩化メチレン (10 ml) に懸濁し、1 規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて 5 分間攪拌した後、塩化メチレンで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オールを得た。得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オールをメタノール 5 ml に溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム 28 mg (0.74 mmol) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液に水素化ホウ素ナトリウム 28 mg (0.74 mmol) を追加して、室温で 20 時間攪拌した。さらに反応液に水素化ホウ素ナトリウム 28 mg (0.74 mmol) を追加して、室温で 7 時間攪拌し、反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣を分取用逆

層HPLCカラム[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GLサイエンス社製、溶出溶媒：アセトニトリル／0.1%酢酸アンモニウム水溶液＝70／30 流速10ml/min]により精製して、(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニル-1-ヒドロキシペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール79mgを得た。得られた(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニル-1-ヒドロキシペンチル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール79mg(0.23mmol)をメタノール(2ml)に溶解し、98%無水シュウ酸9.3mg(0.11mmol)を加えて、室温で30分間攪拌した。減圧下濃縮乾固して、標記化合物57mg(収率30%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.20 (m, 2H), 7.17-7.09 (m, 3H), 5.91 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 5.76 (d, 1H,  $J = 3.4$  Hz), 4.57 (t, 1H,  $J = 6.6$  Hz), 3.59 (d, 1H,  $J = 12.0$  Hz), 3.54 (s, 3H), 3.53 (d, 1H,  $J = 12.0$  Hz), 2.65-2.55 (m, 4H), 2.00-1.80 (m, 4H), 1.70-1.58 (m, 2H), 1.54-1.44 (m, 1H), 1.43-1.32 (m, 1H), 1.30 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3212, 3026, 2935, 2897, 2571, 1719, 1700, 1611, 1521, 1496, 1454, 1405, 1279, 1218, 1053, 767, 721, 700。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 325 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 40)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(2-シクロヘキシルエチルオキシ)フェニル]-1-メチルピロール-2-イル}ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩(例示化合物番号：式 Ia-2 における 1-1444)

(40a) (4R)-4-メチル-4-[2-(5-ヨード-1-メチルピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン

参考例 11 で得られた (4R)-4-メチル-4-[2-(1-メチルピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン 0.61

8.7 g (2.97 mmol) をテトラヒドロフラン (30 ml) に溶解し、氷冷下、ピリジン 1.2 ml (14.9 mmol) およびヨウ素 1.5060 g (5.93 mmol) を加え、同温度にて 10 分間攪拌した。反応液に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、減圧下約 1/2 に濃縮し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2) により精製して、標記化合物 0.6660 g (収率 67%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.30 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.93 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.17 (br s, 1H), 4.15 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.09 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 3.50 (s, 3H), 2.76-2.63 (m, 2H), 1.96-1.85 (m, 2H), 1.42 (s, 3H)。

(40b) (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - {2 - [3 - (2 - シクロヘキシルエチルオキシ) フェニル] - 1 - メチルピロール - 2 - イル} エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

実施例 (40a) で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (5 - オード - 1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 0.3101 g (0.92 mmol)、2 - [3 - (2 - シクロヘキシルエチルオキシ) フェニル] - 4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン 0.4646 g (1.41 mmol)、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (II) 63.1 mg (0.09 mmol) および炭酸セシウム 0.6006 g (1.81 mmol) をジメトキシエタン (8 ml) および水 (2 ml) の混合液に懸濁し、80℃で 6 時間攪拌した。冷却後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2) により精製して粗生成物を得、分取用逆層 HPL



Cカラム [Inertsil ODS-3 (2.0 cm×25 cm)、GLサイエンス社製、溶出溶媒：アセトニトリル／水＝75／25 流速 10 ml/min] により精製して、標記化合物 41.1 mg (収率 11%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 7.30-7.26 (m, 1H), 6.93-6.89 (m, 2H), 6.85-6.83 (m, 1H), 6.14 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.95 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.27 (br s, 1H), 4.18 (d, J = 8.8 Hz), 4.10 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.01 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.52 (s, 3H), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.06-1.94 (m, 2H), 1.78-1.64 (m, 6H), 1.55-1.46 (m, 1H), 1.45 (s, 3H), 1.31-1.11 (m, 4H), 1.02-0.92 (m, 2H)。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 411 (M+H)<sup>+</sup>。

(40c) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(2-シクロヘキシルエチルオキシ)フェニル]-1-メチルピロール-2-イル}ブタン-1-オール 1/2 シュウ酸塩

実施例 (40b) で得られた (4R)-4-メチル-4-[2-{2-[3-(2-シクロヘキシルエチルオキシ)フェニル]-1-メチルピロール-2-イル}エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン 41.0 g (0.10 mmol) をテトラヒドロフラン (1 ml) - メタノール (0.5 ml) の混合液に溶解し、5 規定水酸化カリウム水溶液 (0.5 ml) を加え、4 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NHタイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒：塩化メチレン／メタノール＝50／1) により精製して、(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(2-シクロヘキシルエチルオキシ)フェニル]-1-メチルピロール-2-イル}ブタン-1-オール 36.5 mg を得た。得られた (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(2-シクロヘキシルエチルオキシ)フェニル]-1-メチルピロール-2-イル}ブタン-1-オール 36.2 mg をメタノール (1 ml) に溶解し、無水シュウ酸 (98% 含量) 4.4 mg (0.05 mmol) を加えて、室

温で30分間攪拌した。減圧下濃縮し、2-プロパノールを加え、析出した結晶をろ取し、2-プロパノールで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物35.6mg(収率86%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.27 (t, 1H,  $J = 8.1$  Hz), 6.89 (d, 1H,  $J = 8.1$  Hz), 6.85-6.81 (m, 2H), 6.03 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.91 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.02 (t, 1H,  $J = 6.6$  Hz), 3.63 (d,  $J = 11.7$  Hz), 3.56 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 3.54 (s, 3H), 2.77-2.65 (m, 2H), 2.07-1.90 (m, 2H), 1.81-1.64 (m, 7H), 1.59-1.47 (m, 1H), 1.34 (s, 3H), 1.32-1.15 (m, 3H), 1.05-0.95 (m, 2H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3354, 2923, 2851, 1595, 1579, 1509, 1463, 1301, 1211, 1066, 1049, 763, 698。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 385 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 41)

(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩(例示化合物番号: 式 1a-5 における 4-12)

(41a) (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-{1-エチル-[5-フェニル-1-(5-フェニルペンタノイルオキシ)ペント-1-エニル]ピロール-2-イル}ブタン

参考例 24 で得られた (2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(1-エチルピロール-2-イル)ブタン 2.1g (7.49 mmol) をトルエン (100 ml) に溶解し、ジメチルアミノピリジン 4.58g (37.5 mmol) を加え、5-フェニル吉草酸クロリド 4.4g (22.5 mmol) をトルエン (20 ml) に溶解した溶液を加え、5日間加熱還流した。室温に戻し、反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: ヘキサン/

酢酸エチル＝4／6)により精製して粗生成物を得、分取用逆層HPLCカラム [Inertsil ODS-3 (2.0 cm×25 cm)、GLサイエンス社製、溶出溶媒：アセトニトリル／0.1%酢酸アンモニウム水溶液＝70／30 流速10 ml/min] により精製して、標記化合物2.8 g (収率66%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.26-7.21 (m, 4H), 7.18-7.09 (m, 6H), 6.98 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 5.43 (br s, 1H), 4.35-4.28 (m, 1H), 4.33 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.12 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 2.65-2.25 (m, 9H), 2.10 (s, 3H), 2.07-1.86 (m, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.62-1.47 (m, 6H), 1.37 (s, 3H), 1.25 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(41b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール 塩酸塩

実施例(41a)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-{1-エチル-[5-フェニル-1-(5-フェニルペンタノイルオキシ)ペント-1-エニル]ピロール-2-イル}ブタン2.8 g (4.66 mmol)をメタノール(12 ml)、テトラヒドロフラン(12 ml)および水(12 ml)に溶解し、水酸化リチウム1水和物1.96 g (46.6 mmol)を加え50℃にて5時間攪拌した。室温に戻し、水を加えて塩化メチレンで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル(NHタイプ)クロマトグラフィー(溶出溶媒：塩化メチレン／メタノール＝10／1)により精製して、粗製の(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール1.53 gを得た。得られた粗生成物1.53 gをエタノール(15 ml)に溶解し、氷冷下、4規定塩酸-ジオキサン溶液1.07 ml (4.26 mmol)を加えた。氷冷下30分攪拌後、減圧下濃縮乾固し、

得られた残渣を酢酸エチルから再結晶して、標記化合物 1. 46 g (収率 80%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.90 (br s, 2H), 7.29-7.24 (m, 2H), 7.20-7.13 (m, 3H), 7.06 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 5.94 (d, 1H,  $J = 4.0$  Hz), 5.53 (t, 1H,  $J = 4.8$  Hz), 4.29 (q, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 3.49 (dd, 1H,  $J = 11.0$  Hz, 4.8 Hz), 3.43 (dd, 1H,  $J = 11.0$  Hz, 4.8 Hz), 2.79-2.70 (m, 2H), 2.69-2.55 (m, 4H), 1.94-1.88 (m, 2H), 1.64-1.53 (m, 4H), 1.22 (s, 3H), 1.17 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3377, 2936, 1639, 1479, 1393, 1068。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 357( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

#### (実施例 42)

(2R) - 2-アミノ-2-メチル-4- [5- (5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル] ブタン-1-オール (例示化合物番号 : 式 Ia-4 における 3-12)

(42a) (4R) - 4-メチル-4- {2- [5- (5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル] エチル} - 1, 3-オキサゾリジン-2-オン

参考例 28 で得られた (4R) - 4-メチル-4- [2- (ピロール-2-イル) エチル] - 1, 3-オキサゾリジン-2-オン 138 mg (0.71 mmol) をテトラヒドロフラン (5 ml) に溶解し、メチルマグネシウムブロミドのエーテル (3.0 M) 溶液 0.50 ml (1.49 mmol) を加え、30 分間加熱還流した。冷後、室温攪拌下、5-フェニル吉草酸クロリド 0.169 g (22.5 mmol) をテトラヒドロフラン (1 ml) に溶解した溶液を加え、1 時間加熱還流した。室温に戻し、反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : 酢酸エチル/ヘキサン = 2/1) により精製して粗生成物を得、

分取用逆層HPLCカラム [Inertsil ODS-3 (2.0 cm×25 cm)、GLサイエンス社製、溶出溶媒：アセトニトリル／水＝70／30 流速20 ml/min] により精製して、標記化合物41 mg (収率16%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 9.67 (br s, 1H), 7.31-7.22 (m, 3H), 7.20-7.13 (m, 2H), 6.85-6.78 (m, 1H), 6.03-5.96 (m, 1H), 5.70 (br s, 1H), 4.16 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.07 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 2.80-2.67 (m, 4H), 2.67-2.58 (m, 2H), 2.01-1.88 (m, 2H), 1.81-1.61 (m, 4H), 1.37 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ) : 3442, 3271, 2935, 2861, 1758, 1632, 1492, 1454, 1410, 1382, 1046, 940。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 355 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(42b) (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール

実施例(42a)で得られた(4R)-4-メチル-4-{2-[5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]エチル}-1,3-オキサゾリジン-2-オン41.0 mg (0.12 mmol)をメタノール(2 ml)、テトラヒドロフラン(2 ml)および水(2 ml)に溶解し、10規定水酸化ナトリウム水溶液0.12 ml (1.17 mmol)を加え、4日間加熱還流した。室温に戻し、水を加え酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル(NHタイプ)クロマトグラフィー(溶出溶媒：塩化メチレン／メタノール＝20／1)により精製して、標記化合物30.0 mg (収率79%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz);  $\delta$  : 9.90 (br s, 1H), 7.32-7.22 (m, 3H), 7.20-7.12 (m, 2H), 6.79 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.98 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 3.40 (d, 1H,  $J = 10.3$  Hz), 3.35 (d, 1H,  $J = 10.3$  Hz), 2.80-2.59 (m, 6H), 2.01-1.62 (m, 6H), 1.11 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ): 3272, 2927, 2857, 1624, 1494, 1454, 1410, 1363, 1293, 1263, 1210, 1048, 915, 801, 749, 700.

マススペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 329( $(\text{M}+\text{H})^+$ ).

(実施例 43)

リン酸 モノ (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] - 1 - プチル エステル (例示化合物番号: 式 11a-2 における 5-1344)

(43a) (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール

実施例 (33b) で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ブタン - 1 - オール 塩酸塩 1.4647 g (3.87 mmol) を塩化メチレン (38 ml) に溶解し、ジ-t-ブチルジカルボナート 1.0126 g (4.64 mmol) およびトリエチルアミン 1.62 ml (11.65 mmol) を加え、室温で 18 時間攪拌した。減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 3/2) により精製して、標記化合物 1.6928 g (収率 99%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz),  $\delta$ : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.90 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 5.95 (d, 1H,  $J = 3.7 \text{ Hz}$ ), 4.63 (br s, 1H), 3.98 (br s, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.68 (d, 2H,  $J = 6.6 \text{ Hz}$ ), 2.75 (t, 2H,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ), 2.70-2.62 (m, 3H), 2.55 (ddd, 1H,  $J = 15.4 \text{ Hz}, 12.4 \text{ Hz}, 5.1 \text{ Hz}$ ), 2.13-2.04 (m, 1H), 1.96-1.89 (m, 1H), 1.79-1.64 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.21 (s, 3H).

マススペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 443( $(\text{M}+\text{H})^+$ ).

(43b) リン酸 (2R)-2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル ジアリル エステル

実施例(43a)で得られた(2R)-2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール1.6928g(3.83mmol)を塩化メチレン(19ml)に溶解し、氷冷下、1*H*-テトラゾール1.7933g(25.60mmol)およびジアリル ジイソプロピルホスホロアミダイト2.02ml(7.64mmol)を加え、その後室温で2時間攪拌した。反応液に、氷冷下、*t*-ブチルヒドロパーオキシドの*n*-デカン(5-6mol/l)溶液2.3ml(11.5mmol)を加え、同温度で15分間攪拌した。反応液に亜硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製して、標記化合物 1.5690g(収率68%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.89 (d, 1H, *J* = 3.7 Hz), 5.99-5.89 (m, 3H), 5.39-5.29 (m, 4H), 4.62 (br s, 1H), 4.60-4.52 (m, 4H), 4.21 (dd, 1H, *J* = 9.5 Hz, 5.1 Hz), 4.01 (dd, 1H, *J* = 9.5 Hz, 5.9 Hz), 3.86 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, *J* = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, *J* = 8.1 Hz), 2.58 (t, 2H, *J* = 8.1 Hz), 2.22-2.12 (m, 1H), 1.90-1.81 (m, 1H), 1.79-1.64 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.26 (s, 3H)。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>), *m/z* : 603((*M*+*H*)<sup>+</sup>)。

(43c) リン酸 モノ (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル

実施例(43b)で得られたリン酸 (2R)-2-*t*-ブトキシカルボ

ニルアミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル ジアリル エステル 1.5665 g (2.60 mmol)、トリフェニルホスフィン 0.1402 g (0.54 mmol) およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0) 0.1503 g (0.13 mmol) をアセトニトリル (26 ml) に懸濁し、窒素雰囲気下、ピロリジン 1.1 ml (13 mmol) を加え、室温で 24 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に 1 規定塩酸水溶液を加えて塩化メチレンで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して粗生成物 1.4625 g を得た。得られた粗生成物 1.4625 g を塩化メチレン (26 ml) に溶解し、氷冷下でトリフルオロ酢酸 (8.6 ml) を加え、室温に戻して 2 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にエタノールを加え、析出結晶をろ取して粗結晶を得た。得られた粗結晶をメタノール (200 ml) と水 (67 ml) の混合溶媒に溶解し、活性炭で処理した後セライトろ過した。減圧下濃縮し、残渣にエタノールを加え、析出結晶をろ取し、エタノールで洗浄後乾燥して、標記化合物 0.5554 g (収率 51%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{CO}_2\text{D}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.22 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 7.07 (d, 1H,  $J = 4.4$  Hz), 6.04 (d, 1H,  $J = 4.4$  Hz), 4.17 (d, 2H,  $J = 10.3$  Hz), 3.87 (s, 3H), 2.82-2.71 (m, 4H), 2.63 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.20-2.01 (m, 2H), 1.75-1.63 (m, 4H), 1.46 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3429, 2934, 2857, 2717, 2603, 1639, 1557, 1480, 1455, 1378, 1182, 1056, 1041, 946, 915, 821, 748, 699, 580, 511。  
マススペクトル (FAB $^-$ ),  $m/z$  : 421 ( $(\text{M}-\text{H})^-$ )。

#### (実施例 44)

(3R)-3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸(例示化合物番号: 式 IIIa-2 における 5-1344)



(44a) (2R)-2-tert-butoxycarbonylamino-2-methyl-4-[1-methyl-5-(5-phenylpentanoyl)pyrrol-2-yl]butan-1-ol

実施例(43a)で得られた(2R)-2-tert-butoxycarbonylamino-2-methyl-4-[1-methyl-5-(5-phenylpentanoyl)pyrrol-2-yl]butan-1-ol 0.3520 g (0.80 mmol)を塩化メチレン(8 ml)に溶解し、モレキュラーシーブ4 Å (0.2234 g)および重クロム酸ピリジニウム0.4594 g (1.22 mmol)を加え、室温で20時間攪拌した。反応液にエーテルを加え、ろ過し、ろ液を減圧下留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製して、標記化合物0.2195 g(収率63%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 9.36 (s, 1H), 7.28-7.25 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 3H), 6.89 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.92 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.20 (br s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.59-2.52 (m, 1H), 2.45-2.28 (m, 2H), 2.09-2.03 (m, 1H), 1.78-1.64 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.40 (s, 3H)。

(44b) ジエチル (3R)-3-tert-butoxycarbonylamino-3-methyl-5-[1-methyl-5-(5-phenylpentanoyl)pyrrol-2-yl]pentan-1-yl phosphonate ester

水素化ナトリウム(60%含量)31.0 mg (0.78 mmol)をテトラヒドロフラン(1 ml)に懸濁し、氷冷下、テトラエチルメチレンジホスホナート0.185 ml (0.75 mmol)を5分間要して加え、その後室温にて30分間攪拌した。ついで、実施例(44a)で得られたジエチル(2R)-2-tert-butoxycarbonylamino-2-methyl-4-[1-methyl-5-(5-phenylpentanoyl)pyrrol-2-yl]-1-butanol 0.2155 g (0.49 mmol)をテトラヒドロフラン(4 ml)に溶解した溶液を氷冷下、5分間要して加え、同温度にて30分間攪

拌した。反応液に酢酸  $42 \mu\text{l}$  ( $0.73 \text{ mmol}$ ) を加えて中和したのち減圧下濃縮し、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン =  $2/1 \sim 1/0$ )により精製して、標記化合物  $0.2348 \text{ g}$  (収率  $85\%$ ) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ),  $\delta$ :  $7.28\text{--}7.25$  (m,  $2\text{H}$ ),  $7.18\text{--}7.15$  (m,  $3\text{H}$ ),  $6.90$  (d,  $1\text{H}$ ,  $J = 4.4 \text{ Hz}$ ),  $6.77$  (dd,  $1\text{H}$ ,  $J = 22.7 \text{ Hz}$ ,  $17.6 \text{ Hz}$ ),  $5.92$  (d,  $1\text{H}$ ,  $J = 4.4 \text{ Hz}$ ),  $5.72$  (t,  $1\text{H}$ ,  $J = 17.6 \text{ Hz}$ ),  $4.59$  (br s,  $1\text{H}$ ),  $4.12\text{--}4.05$  (m,  $4\text{H}$ ),  $3.84$  (s,  $3\text{H}$ ),  $2.74$  (t,  $2\text{H}$ ,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ),  $2.64$  (t,  $2\text{H}$ ,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ),  $2.59\text{--}2.50$  (m,  $2\text{H}$ ),  $2.26\text{--}2.18$  (m,  $1\text{H}$ ),  $2.01\text{--}1.93$  (m,  $1\text{H}$ ),  $1.78\text{--}1.64$  (m,  $4\text{H}$ ),  $1.42$  (s,  $12\text{H}$ ),  $1.32$  (t,  $6\text{H}$ ,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ).

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ :  $575$  ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ).

(44c) ジエチル (3R) - 3 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ペンチルホスホン酸 エステル

実施例 (44b) で得られたジエチル (3R) - 3 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ペント - 1 - エニルホスホン酸 エステル  $145.4 \text{ mg}$  ( $0.25 \text{ mmol}$ ) をエタノール ( $2.5 \text{ ml}$ ) に溶解し、塩化トリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I)  $23.7 \text{ mg}$  ( $0.026 \text{ mmol}$ ) を加え、水素雰囲気下、 $50^\circ\text{C}$  で5時間攪拌した。冷後、反応液に塩化トリス (トリフェニルホスフィン) ロジウム (I)  $24.3 \text{ mg}$  ( $0.026 \text{ mmol}$ ) を加え、水素雰囲気下、 $50^\circ\text{C}$  で5時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル)により精製して、粗生成物  $154.0 \text{ mg}$  を得、分取用逆層 HPLC カラム [Inertsil ODS-3 ( $2.0 \text{ cm} \times 25 \text{ cm}$ ), GLサイエンス社製、溶出溶媒: アセトニトリル/水 =  $80/20$ 、流速:  $10 \text{ ml}$

/min]で精製して、標記化合物 116. 1mg (収率 80%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.89 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.92 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.37 (br s, 1H), 4.14-4.05 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.74 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.64 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.59-2.50 (m, 2H), 2.24-2.15 (m, 2H), 1.83-1.64 (m, 8H), 1.42 (s, 9H), 1.33 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz), 1.32 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz), 1.21 (s, 3H)。

マスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 577( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(44d) (3R) - 3 - アミノ - 3 - メチル - 5 - [5 - (5 - フェニルペンタノイル) フラン - 2 - イル] ペンチルホスホン酸

実施例 (44c) で得られたジエチル (3R) - 3 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - メチル - 5 - [1 - メチル - 5 - (5 - フェニルペンタノイル) ピロール - 2 - イル] ペンチルホスホン酸 エステル 114. 0mg (0. 20mmol) を塩化メチレン (2. 0ml) に溶解し、臭化トリメチルシラン 0. 26ml (1. 97mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で 5 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去したのち、残渣に含水エタノールを加えて希釈し、これにアンモニア水溶液および酢酸を加えて pH4 として結晶を析出させた。析出結晶をろ取り、水およびエタノールで洗浄後乾燥して、標記化合物 52. 0mg (収率 63%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{CO}_2\text{D}$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.26-7.22 (m, 2H), 7.18-7.12 (m, 3H), 7.07 (d, 1H,  $J = 4.1$  Hz), 6.05 (d, 1H,  $J = 4.1$  Hz), 3.88 (s, 3H), 2.80 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.73 (t, 2H,  $J = 8.8$  Hz), 2.63 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.23-1.94 (m, 6H), 1.76-1.64 (m, 4H), 1.48 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3171, 3025, 2936, 2859, 2549, 1640, 1552, 1484, 1461, 1380, 1136, 1064, 1051, 914, 881, 772, 741, 699。

マスペクトル ( $\text{FAB}^-$ ),  $m/z$  : 419( $(\text{M}-\text{H})^-$ )。

(参考例 1)

臭化 (フラン-2-イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩

フルフリルアルコール 29.43 g (300 mmol) をテトラヒドロフラン (300 ml) に溶解し、三臭化リン 10 ml (105 mmol) をテトラヒドロフラン (30 ml) に溶解した溶液を、氷冷撹拌下、30 分かけて加え、反応混合物を室温にて 1 時間撹拌した。反応混合物に、水酸化ナトリウム水溶液 (30.23 g を水 75 ml に溶解) を加えて中和した後、有機層を分取し、さらに水酸化ナトリウム 10 g を加えて有機層を乾燥した。有機層を傾斜法により分取し、無水硫酸ナトリウムと活性炭を加え、ろ過し、テトラヒドロフラン (150 ml) を加え、トリフェニルホスフィン 78.64 g (300 mmol) を加え、70℃にて 2 時間撹拌した。冷却後、析出した結晶をろ取し、酢酸エチルにて洗浄した後、減圧下乾燥して、標記化合物 98.84 g (収率 78%) を得た。

(参考例 2)

(2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (フラン-2-イル) - 3 - プテン

(2a) (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパノール

2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - メチルプロパン-1, 3 -ジオール 20.0 g (97.4 mmol) をイソプロピルエーテル (200 ml) に懸濁し、ヘキサン酸ビニルエステル 16.3 ml (0.10 mol) 及びリパーゼ [Immobilized lipase from *Pseudomonas* sp., TOYOBOKU 社製、0.67 U/mg] 0.8 g を加え、室温で 2 時間撹拌した。反応液をろ過後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 10/1 ~ 2/1) により精製して、標記化合物 25.0 g (収率 85%) を得た。

得られた (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパノールは、分析用光学活性 HPLC

カラム[ChiralCel OF (0.46 cm×25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒：ヘキサン／2-プロパノール＝70／30、流速：0.5 ml/min)]で光学純度を決定した。

先に溶出されるもの(8.2分)が2S体であり、後から溶出されるもの(10.5分)が2R体であり、光学純度は85% eeであることを確認した。

旋光度,  $[\alpha]_D = -8.5$  ( $c=1.86$ ,  $\text{CHCl}_3$ )。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$ : 4.86 (s, 1H), 4.25 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 4.19 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 3.86 (br s, 1H), 3.70-3.55 (m, 2H), 2.36 (t, 2H,  $J = 7.4$  Hz), 1.44 (s, 9H), 1.40-1.30 (m, 4H), 1.25 (s, 3H), 0.90 (t, 3H,  $J = 7.0$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (Liquid Film): 3415, 3380, 2961, 2935, 2874, 1721, 1505, 1458, 1392, 1368, 1293, 1248, 1168, 1076。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 304 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(2b) (2S) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-n-ヘキサノイルオキシ-2-メチル-1-プロパノール

参考例(2a)で得られた(2R) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-n-ヘキサノイルオキシ-2-メチル-1-プロパノール 30.70 g (0.101 mol) を塩化メチレン (600 ml) に溶解し、モレキュラーシーブ 4 Å (220 g) およびクロロクロム酸ピリジニウム 43.6 g (0.202 mol) を氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応液にエーテルを加え、ろ過し、ろ液を減圧下留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝10／1～5／1)により精製して、標記化合物 28.81 g (収率 95%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$ : 9.45 (s, 1H), 5.26 (br s, 1H), 4.44 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 4.32 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 2.32 (t, 2H,  $J = 7.46$  Hz), 1.70-1.55 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.38 (s, 3H), 1.40-1.25 (m, 4H), 0.90 (t, 3H,  $J = 7.0$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (Liquid Film) : 3367, 2961, 2935, 2874, 1742, 1707, 1509, 1458, 1392, 1369, 1290, 1274, 1254, 1166, 1100, 1078.

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$  : 302 ((M+H)<sup>+</sup>).

(2c) (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) - 3 - ブテン

参考例 1 で得られた臭化 (フラン - 2 - イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩 33.65 g (79.5 mmol) をテトラヒドロフラン (90 ml) に懸濁し、氷冷攪拌下、t - ブトキシカリウム 8.94 g (79.7 mmol) をテトラヒドロフラン (90 ml) に溶解した溶液を 10 分間かけて加え、さらに氷冷下 15 分間攪拌した。ついで、参考例 (2b) で得られた (2S) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパナール 16.18 g (53.7 mmol) をテトラヒドロフラン (60 ml) に溶解した溶液を 15 分間かけて加え、氷冷下 30 分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、液温を室温に戻し、減圧下濃縮し、水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒 : ヘキサン / 酢酸エチル = 10 / 1) により精製して、標記化合物 19.32 g (収率 98%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz),  $\delta$  : 7.45 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 7.33 (d, 1H, J = 1.5 Hz), 6.41 (dd, 1H, J = 2.9 Hz, 1.6 Hz), 6.36-6.35 (m, 計 2H), 6.33 (d, 1H, J = 15.9 Hz), 6.26-6.22 (m, 計 2H), 6.20 (d, 1H, J = 15.9 Hz), 5.59 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 5.22 (br s, 1H), 4.82 (br s, 1H), 4.43 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.32 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.25 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 2.36-2.32 (m, 計 4H), 1.67-1.22 (m, 計 40H), 0.92-0.87 (s, 計 6H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  (Liquid Film) : 3445, 2962, 2933, 2873, 2250, 1720, 1497, 1457, 1391, 1368, 1249, 1165, 1075, 1015.

マススペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 388((M+Na)<sup>+</sup>), 366((M+H)<sup>+</sup>)。

(参考例 3)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エテニル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 (2c) で得られた (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) - 3 - ブテン 19.32 g (52.9 mmol) をテトラヒドロフラン (53 ml) およびメタノール (53 ml) の混合液に溶解し、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 53 ml を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液に水および塩化メチレンを加えて、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、粗生成物 14.84 g (収率 100%) を得た。粗生成物をテトラヒドロフラン (150 ml) に溶解し、t - ブトキシカリウム 7.20 g (64.2 mmol) をテトラヒドロフラン (50 ml) に溶解した溶液を氷冷下 10 分間かけて加え、同温度下で 1 時間攪拌した。反応液に酢酸 3.65 ml (63.8 mmol) を加えて中和し、減圧下濃縮して、水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) により精製して、標記化合物 10.04 g (収率 98%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.49 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 7.36 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 6.46 (d, 1H, J = 2.1 Hz), 6.43 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 6.04-6.37 (m, 計 2H), 6.30 (br s, 1H), 6.30 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.21 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 6.18 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 5.88 (br s, 1H), 5.62 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 4.41 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 4.37 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 4.23 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 1.65 (s, 3H), 1.54 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 3451, 2252, 1757, 1396, 1374, 1281, 1165, 1044, 1016.

マスペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$ : 193 ( $\text{M}^+$ ), 178 (base), 163, 148, 135, 120, 107, 91, 81, 65.

(参考例 4)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

10%パラジウム-炭素 (50%含水) 1.00 g をメタノール (20 ml) に懸濁し、参考例 3 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 10.04 g (52.0 mmol) をメタノール (180 ml) に溶解した溶液を加え、水素雰囲気下、室温で 40 分間攪拌した。反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過した後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 3/2 ~ 1/1) により精製して、標記化合物 7.95 g (収率 78%) を得た。

得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 -オンは、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralPak AD (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n-ヘキサン/2-プロパノール = 85/15、流速: 1.0 ml/min] により光学純度を決定した。

先に溶出されるもの (13.09 分) が 4S 体であり、後から溶出されるもの (15.43 分) が 4R 体であり、光学純度は 84% ee であることを確認した。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz),  $\delta$ : 7.31 (br s, 1H), 6.29 (br d, 1H,  $J = 2.6$  Hz), 6.03 (d, 1H,  $J = 2.6$  Hz), 5.92 (br s, 1H), 4.11 (d, 1H,  $J = 8.4$  Hz), 4.04 (d, 1H,  $J = 8.4$  Hz), 2.72 (t, 2H,  $J = 8.0$  Hz), 1.98-1.94 (m, 2H), 1.68-1.61 (m, 2H), 1.38 (s, 3H)。



IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 3450, 2975, 2928, 2250, 1755, 1599, 1508, 1400, 1381, 1147, 1045, 1010.

マスペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$ : 195 ( $\text{M}^+$ ), 178, 164, 134, 121, 100 (base), 96, 94, 81, 56.

(参考例 5)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン

(5a) (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - (-) - 酒石酸塩

参考例 4 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 29.9 g (153.2 mmol) をテトラヒドロフラン (150 ml) およびメタノール (150 ml) の混合液に溶解し、5 規定水酸化カリウム水溶液 (150 ml) を加え、3 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をエタノール 250 ml に溶解し、D - (-) - 酒石酸塩 11.5 g (76.6 mmol) をエタノール (100 ml) に溶解した溶液を加えて 10 分攪拌した後、析出した粗結晶をエタノール (300 ml) と水 (75 ml) の混合溶媒から再結晶し、無色板状晶として標記化合物 24.4 g (収率 65%) を得た。

得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - (-) - 酒石酸塩 51.2 mg (0.16 mmol) を塩化メチレン (1.6 ml) に懸濁し、ジ-tert-ブチルジカルボナート 0.17 g (0.78 mmol)、トリエチルアミン 0.22 ml (1.58 mmol) および 4 - ジメチルアミノピリジン 3.0 mg (0.025 mmol) を加え、室温で 20 分間攪拌した。水を加え、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル

= 1 / 1)により精製して、(4 R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 18.0 mg (収率 58%)を得た。

得られた (4 R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オンは、参考例 4 に準じて、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralPak AD (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n - ヘキサン / 2 - プロパノール = 85 / 15、流速: 1.0 ml / min] により光学純度を決定した。

先に溶出されるもの (13.09 分) が 4 S 体であり、後から溶出されるもの (15.43 分) が 4 R 体であり、光学純度は 99.3% ee であることを確認した。

これにより、先に得られた (2 R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1 / 2 D - (-) - 酒石酸塩の光学純度は 99.3% 以上であることを確認した。

融点: 225°C。

旋光度,  $[\alpha]_D = -13.43$  ( $c = 1.00$ , MeOH)。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz),  $\delta$ : 7.36 (d, 1H,  $J = 2.0$  Hz), 6.30 (dd, 1H,  $J = 2.8$  Hz, 2.0 Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 2.8$  Hz), 3.58 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 3.51 (d, 1H,  $J = 11.6$  Hz), 2.77-2.68 (m, 2H), 2.07-1.88 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max} \text{ cm}^{-1}$  (KBr): 3405, 3226, 3135, 2943, 2597, 1598, 1528, 1401, 1299, 1228, 1124, 1079, 1003, 740。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$ : 170 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ; free 体)。

元素分析値 ( $\text{C}_9\text{H}_{15}\text{NO}_2 \cdot 1/2\text{C}_4\text{H}_6\text{O}_6$  として%),

計算値: C: 54.09, H: 7.43, N: 5.73。

実測値: C: 53.93, H: 7.30, N: 5.79。

(5 b) (2 R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン

参考例(5a)で得られた(2R)-2-アミノ-2-メチル-4-(フラン-2-イル)ブタン-1-オール 1/2D-(-) -酒石酸塩 24.21g (99.1mmol)を塩化メチレン(400ml)および水(100ml)の混合液に懸濁し、水酸化ナトリウム水溶液(97%水酸化ナトリウム 22.34gを水100mlに溶解)を加え、室温で20分間攪拌した。反応液を塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩化メチレン(500ml)に溶解し、トリエチルアミン138ml (993mmol)、無水酢酸46.5ml (493mmol)および4-ジメチルアミノピリジン1.21g (9.9mmol)を加え、室温で1時間攪拌した後、メタノールを加えて反応を止め、減圧下溶媒を留去した。残渣に酢酸エチルおよび水を加えて、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=2/1)により精製して、標記化合物 25.11g (収率100%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$ : 7.30(d, 1H,  $J = 1.8$  Hz), 6.28(dd, 1H,  $J = 3.0$  Hz, 1.8 Hz), 6.01(d, 1H,  $J = 3.0$  Hz), 5.36(br s, 1H), 4.30(d, 1H,  $J = 11.1$  Hz), 4.17(d, 1H,  $J = 11.1$  Hz), 2.66(t, 2H,  $J = 8.3$  Hz), 2.30-2.22(m, 1H), 2.09(s, 3H), 2.02-1.94(m, 1H), 1.92(s, 3H), 1.35(s, 3H)。

マススペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$ : 253( $\text{M}^+$ ), 211, 194, 180, 138, 134(base), 121, 99, 94, 81, 74, 57, 43。

#### (参考例6)

(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(5-ブロモフラン-2-イル)ブタン

参考例(5b)で得られた(2R)-1-アセトキシ-2-アセチルアミノ-2-メチル-4-(フラン-2-イル)ブタン 5.85g (23.1m

mmol) をN, N-ジメチルホルムアミド (100 ml) に溶解し、N-ブ  
ロモコハク酸イミド 4.32 g (24.3 mmol) を氷冷下少量ずつ加え、  
同温度下 30 分間攪拌した。反応液に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液およ  
び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、エーテルで抽出し、エーテル層を  
飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒  
を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘ  
キサン = 2/1) により精製して、粗生成物を得、分取用逆層 HPLC カラム  
[TSK-GEL ODS-80Ts (5.0 cm × 30 cm)、東ソー社製、溶出溶媒:  
アセトニトリル/水 = 50/50、流速: 40 ml/min] で精製して、標  
記化合物 2.95 g (収率 38%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.18 (d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 5.99  
(d, 1H,  $J = 3.3$  Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 4.16  
(d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 2.70-2.57 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10 (s, 3H),  
2.01-1.93 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (Liquid film) : 3300, 3074, 2978, 2938, 1742,  
1658, 1549, 1510, 1450, 1373, 1241, 1128, 1012, 945, 922, 784, 733, 605。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 332 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

#### (参考例 7)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (5 -  
ヨードフラン - 2 - イル) ブタン

参考例 (5b) で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミ  
ノ - 2 - メチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン 5.11 g (19.8 mmol)  
をクロロホルム (100 ml) に溶解し、ピリジン 8.0 ml (99.1 mmol) およびヨウ素 10.07 g (39.7 mmol) を加え、  
60℃で 3 時間攪拌した。冷却後、反応液に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶  
液を加えて反応を止め、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を水、飽和  
炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム

で乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=3/2)により精製して、粗生成物5.57gを得、分取用逆層HPLCカラム[TSK-GEL ODS-80Ts (5.0cm×30cm)、東ソー社製、溶出溶媒:アセトニトリル/水=50/50、流速:40ml/min]で精製して、標記化合物2.9467g(収率39%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.42 (d, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 5.95 (d, 1H,  $J = 3.1$  Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H,  $J = 11.1$  Hz), 4.16 (d, 1H,  $J = 11.1$  Hz), 2.72-2.63 (m, 2H), 2.29-2.21 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.05-1.93 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ) : 3444, 2941, 1736, 1681, 1598, 1512, 1374, 1252, 1103, 1043, 1011, 947, 912。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 380 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

#### (参考例8)

ヨウ化 (1-メチルピロール-2-イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩

1-メチルピロール21.42g (264.1mmol) に、35%ホルムアルデヒド水溶液20.8ml (264.3mmol) とジメチルアミン塩酸塩22.70g (278.4mmol) の混合物を、氷冷攪拌下、1時間30分間かけて加え、室温で6時間攪拌した。反応液に10%水酸化ナトリウム水溶液(150ml)を加え、エーテルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製して、2-(N,N-ジメチルアミノメチル)-1-メチルピロール31.47g(収率86%)を得た。2-(N,N-ジメチルアミノメチル)-1-メチルピロール30.00g (217.5mmol) をエタノール(220ml)に溶解し、氷冷下、ヨウ化メチル16.2ml (2

60.2 mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(220 ml)を加え、析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して、ヨウ化(1-メチルピロール-2-イル)メチルトリメチルアンモニウム塩55.34 g(収率91%)を得た。

ヨウ化(1-メチルピロール-2-イル)メチルトリメチルアンモニウム塩55.34 g(197.5 mmol)をアセトニトリル(400 ml)に懸濁し、トリフェニルホスフィン62.20 g(237.1 mmol)を加え、80℃で10時間攪拌した。冷却後、減圧下、約1/2に濃縮し、酢酸エチル(200 ml)を加え、析出した結晶をろ取し、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物77.14 g(収率81%)を得た。

#### (参考例9)

(2R)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-1-n-ヘキサノイルオキシ-2-メチル-4-(1-メチルピロール-2-イル)-3-ブテン

参考例8で得られたヨウ化(1-メチルピロール-2-イル)メチルトリフェニルホスホニウム塩および参考例(2b)で得られた(2S)-2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-n-ヘキサノイルオキシ-2-メチル-1-プロパナールを出発原料として、参考例(2c)に記載の方法に準じて、標記化合物(収率80%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.60 (t, 1H,  $J = 2.3$  Hz), 6.57 (t, 1H,  $J = 2.3$  Hz), 6.38 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 6.30-6.26 (m, 計2H), 6.27 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 6.11 (t, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 6.08 (t, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 5.99 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 5.58 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz) 5.04 (br s, 1H), 4.81 (br s, 1H), 4.34-4.16 (m, 計4H), 3.60 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.36-2.30 (m, 計4H), 1.67-1.22 (m, 計4H), 0.92-0.87 (s, 計6H)。

マススペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$  : 280( $\text{M}^+$ ), 249, 224, 193(base), 164, 149, 132, 108, 94, 57。

## (参考例 10)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エテニル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 9 で得られた (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) - 3 - ブテンを出発原料として、参考例 3 に記載の方法に準じて、標記化合物 (収率 76%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.67 (t, 1H,  $J = 2.1$  Hz), 6.62 (t, 1H,  $J = 1.5$  Hz), 6.48 (d, 1H,  $J = 15.7$  Hz), 6.36 (dd, 1H,  $J = 3.7$  Hz, 1.5Hz), 6.31 (d, 1H,  $J = 12.2$  Hz), 6.14-6.10 (m, 計 2H), 6.07 (br d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 5.99 (d, 1H,  $J = 15.7$  Hz), 5.65 (d, 1H,  $J = 12.2$  Hz) 5.46 (br s, 1H), 5.11 (br s, 1H), 4.31 (d, 1H,  $J = 8.2$  Hz), 4.22 (d, 1H,  $J = 8.2$  Hz), 4.17 (d, 1H,  $J = 8.2$  Hz), 4.16 (d, 1H,  $J = 8.2$  Hz), 3.62 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 1.59 (s, 3H), 1.57 (s, 3H)。

マスペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$  : 206 ( $\text{M}^+$ , base), 191, 176, 161, 147, 132, 120, 106, 94, 81, 77。

## (参考例 11)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 10 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エテニル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オンを出発原料として、参考例 4 に記載の方法に準じて、標記化合物 (収率 78%) を得た。

得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 -オンは、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralCel 0J (0.46 cm  $\times$  25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n - ヘキサン / 2 - プロパノール = 70 / 30、流速: 1.0 ml / m

i n]により光学純度を決定した。

先に溶出されるもの(12.29分)が4S体であり、後から溶出されるもの(15.39分)が4R体であり、光学純度は75% eeであることを確認した。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.58 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 6.05 (dd, 1H,  $J = 3.2$  Hz, 2.4 Hz), 5.88 (br d, 1H,  $J = 3.2$  Hz), 5.15 (br s, 1H), 4.14 (d, 1H,  $J = 8.3$  Hz), 4.07 (d, 1H,  $J = 8.3$  Hz), 2.70-2.58 (m, 2H), 2.00-1.87 (m, 2H), 1.42 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  (KBr) : 3289, 3103, 2977, 2938, 1759, 1713, 1495, 1397, 1381, 1309, 1281, 1231, 1032, 945, 928, 776, 718, 706, 656。

マスマスペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$  : 208( $\text{M}^+$ ), 108(base), 94, 81, 56, 42。

#### (参考例 12)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン

参考例 11 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 1.53 g (7.36 mmol) をテトラヒドロフラン (30 ml) およびメタノール (15 ml) の混合液に溶解し、5 規定水酸化カリウム水溶液 15 ml (75 mmol) を加え、5 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加えて、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩基性シリカゲル (NH タイプ) クロマトグラフィー (溶出溶媒 : 塩化メチレン / メタノール = 100 / 1) により精製して、生成物 1.32 g (収率 98%) を得た。生成物 1.32 g (7.24 mmol) を塩化メチレン (36 ml) に溶解し、トリエチルアミン 10.0 ml (71.9 mmol)、無水酢酸 3.4 ml (36.1 mmol) および 4 - ジメチルアミノピリジン 88 mg (0.72 mmol) を加え、室温で 40 分間攪拌した。メタノール 1.46 ml (36.0 mmol) を



加えて反応を止め、減圧下濃縮した。残渣に酢酸エチルおよび水を加え、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2 ~ 1/0)により精製して、標記化合物 1.89 g (収率 98%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.54 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 6.04 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 5.88 (d, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.33 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 4.20 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.89 (m, 4H), 1.38 (s, 3H)。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 267((M+H) $^+$ ), 266(M $^+$ )。

(参考例 13)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチル - 5 - ヨードピロール - 2 - イル) ブタン

参考例 12 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン 1.89 g (7.10 mmol) をクロロホルム (35 ml) に溶解し、氷冷下、ピリジン 2.9 ml (35.9 mmol) およびヨウ素 3.60 g (14.17 mmol) を加え、同温度にて 10 分間攪拌した。反応液に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、室温で減圧下約 1/2 に濃縮し、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン = 3/2)により精製して、標記化合物 1.40 g (収率 50%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.28 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 5.94 (d, 1H,  $J = 3.6$  Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.32 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 4.17 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 3.49 (s, 3H), 2.67-2.59 (m, 2H), 2.27-2.19 (m, 1H),

2.09 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 4H), 1.36 (s, 3H)。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>), m/z : 393 (M+H)<sup>+</sup>, 392 (M<sup>+</sup>)。

(参考例 14)

(2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - エチル - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 4 - (フラン - 2 - イル) - 3 - ブテン

(14a) (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - エチル - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 1 - プロパノール

2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - エチルプロパン - 1, 3 - ジオール 52.9 g (241 mmol) をイソプロピルエーテル (1.0 l) に懸濁し、ヘキサン酸ビニルエステル 41 ml (254 mmol) 及びリパーゼ [Immobilized lipase from *Pseudomonas* sp., TOYOBO 社製、0.67 U/mg] 2.1 g を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応液をろ過後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 7/1 ~ 4/1 ~ 2/1) により精製して、標記化合物 66.8 g (収率 87%) を得た。

得られた (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - エチル - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 1 - プロパノールは、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralCel 0F (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: ヘキサン/2 - プロパノール = 80/20、流速: 0.5 ml/min] で光学純度を決定した。

先に溶出されるもの (7.35 分) が 2S 体であり、後から溶出されるもの (7.86 分) が 2R 体であり、光学純度は 93% ee であることを確認した。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 4.76 (br s, 1H), 4.24 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.10 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 3.65-3.62 (m, 2H), 2.35 (t, 2H, J = 7.7 Hz), 1.78-1.69 (m, 1H), 1.63-1.53 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.30-1.25 (m, 4H), 0.87-0.83 (m, 6H)。

マススペクトル(FAB<sup>+</sup>), m/z : 340((M+Na)<sup>+</sup>), 318((M+H)<sup>+</sup>)。

(14b) (2S) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-2-エチル-3-n-ヘキサノイルオキシ-1-プロパナール

参考例(14a)で得られた(2R) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-3-n-ヘキサノイルオキシ-2-エチル-1-プロパノール66.7g(210mmol)を塩化メチレン(700ml)に溶解し、モレキュラーシーブ4Å(117g)および重クロム酸ピリジニウム117g(311mmol)を氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応液にエーテルを加え、ろ過し、ろ液を減圧下留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=10/1~5/1)により精製して、標記化合物45.9g(収率69%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル(CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 9.34, (s, 1H), 5.30 (br s, 1H), 4.60 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 4.40 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 2.28 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.18-2.06 (m, 1H), 1.79-1.69 (m, 1H), 1.62-1.55 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.34-1.22 (m, 4H), 0.90 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 0.81 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

マススペクトル(FAB<sup>+</sup>), m/z : 338((M+Na)<sup>+</sup>), 316((M+H)<sup>+</sup>)。

(14c) (2R) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-2-エチル-1-n-ヘキサノイルオキシ-4-(フラン-2-イル)-3-ブテン

参考例1で得られた臭化 (フラン-2-イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩4.04g(9.54mmol)をテトラヒドロフラン(32.4ml)に懸濁し、氷冷攪拌下tert-ブトキシカリウム1.06g(9.45mmol)を加え、さらに氷冷下15分間攪拌した。ついで、参考例(14b)で得られた(2S) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-2-エチル-3-n-ヘキサノイルオキシ-1-プロパナール2.01g(6.37mmol)をテトラヒドロフラン(10ml)に溶解した溶液を5分間かけて加え、氷冷下30分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、液温を室温に戻し減圧下濃縮し、水および酢酸エチルを加

えて酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）により精製して、標記化合物 2. 385 g（収率 99%）を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.44 (br d, 1H,  $J = 1.5$  Hz), 7.33 (br d, 1H,  $J = 1.5$  Hz), 6.41 (dd, 1H,  $J = 2.9$  Hz, 1.5 Hz), 6.38 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 6.36 (dd, 1H,  $J = 2.9$  Hz, 1.5 Hz), 6.29 (d, 1H,  $J = 16.8$  Hz), 6.28 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 6.22 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 6.09 (d, 1H,  $J = 16.8$  Hz), 5.47 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 5.21 (br s, 1H), 4.66 (br s, 1H), 4.50 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 4.41 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 4.33 (br s, 2H), 2.31 (q, 計 4H,  $J = 7.7$  Hz), 2.08-1.88 (m, 計 4H), 1.47-1.42 (m, 計 10H), 1.32-1.26 (m, 計 18H), 0.93-0.86 (m, 計 12H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ): 3446, 2970, 2933, 2873, 1722, 1494, 1459, 1391, 1380, 1368, 1249; 1163。

マスマスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 402 ( $(\text{M}+\text{Na})^+$ ), 379 ( $\text{M}^+$ )。

#### (参考例 15)

(4R) - 4 - エチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エテニル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 14 で得られた (2R) - 2 - *t* - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - エチル - 1 - *n* - ヘキサノイルオキシ - 4 - (フラン - 2 - イル) - 3 - ブテン 2.33 g (6.14 mmol) をテトラヒドロフラン (7 ml) およびメタノール (7 ml) の混合液に溶解し、1.8 規定水酸化ナトリウム水溶液 7 ml を加え、室温で 3 時間攪拌した。反応液に水および酢酸エチルを加えて、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、粗生成物 1.68 g (収率 97%) を得た。粗生成物をテトラヒドロフラン (30 ml) に溶解し、*t* - ブトキシカリウム 1.21 g (10.8 mmol) を加え、同

温度下で3時間攪拌した。反応液に水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/1~1/1)により精製して、標記化合物1.24g(収率定量的)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.43 (d, 1H,  $J = 1.5$  Hz), 7.32 (d, 1H,  $J = 1.5$  Hz), 6.45 (dd, 1H,  $J = 3.7$  Hz, 1.5 Hz), 6.44 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 6.39 (dd, 1H,  $J = 3.7$  Hz, 1.5 Hz), 6.37 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.29 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 6.25 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 6.13 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 5.62 (br s, 計 2H), 5.53 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 4.44 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.36 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.24 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.22 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 1.93 (q, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 1.85-1.76 (m, 2H), 0.99 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz), 0.98 (t, 1H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 3453, 2975, 1757, 1396, 1373, 1053, 1015。  
マススペクトル( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$  : 207( $\text{M}^+$ ), 178(base), 135, 107。

#### (参考例 16)

(4R)-4-エチル-4-[2-(フラン-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン

参考例15で得られた(4R)-4-エチル-4-[2-(フラン-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン1.24g(5.9mmol)のメタノール溶液(40ml)に、10%パラジウム-炭素(50%含水)124mgを加え、水素雰囲気下室温で2時間攪拌した。窒素置換後、反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過し、セライトを酢酸エチルで洗浄した。ろ液、洗液を合わせて減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1~1/2)により精製して、標記化合物144.4mg(収率12%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.32 (br d, 1H,  $J = 2.2$  Hz), 6.29

(t, 1H,  $J = 2.2$  Hz), 6.03 (br d, 1H,  $J = 2.2$  Hz), 5.40 (m, 1H), 4.11 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.07 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 2.74-2.67 (m, 2H), 1.97-1.93 (m, 2H), 1.72-1.64 (m, 2H), 0.96 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 3453, 2973, 229, 1757, 1601, 1397, 1380, 1052。

マスマスペクトル ( $\text{EI}^+$ ),  $m/z$ : 209 ( $\text{M}^+$ ), 178, 114, 81 (base)。

(参考例 17)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - エチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン

参考例 16 で得られた (4R) - 4 - エチル - 4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オンをテトラヒドロフラン (2 ml)、メタノール (2 ml) および水 (2 ml) の混合液に溶解し、水酸化カリウム (310 mg) を加え、3 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 1/0 ~ 50/1) により精製して、(2R) - 2 - アミノ - 2 - エチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン - 1 - オールを 104.9 mg (収率 83%) を得た。

得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - エチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタン - 1 - オールを塩化メチレン (2.0 ml) に溶解し、トリエチルアミン 0.64 ml (4.59 mmol)、無水酢酸 0.32 ml (3.39 mmol) および 4 - ジメチルアミノピリジン 28 mg (0.23 mmol) を加え、室温で 2.5 時間攪拌した後、メタノールを加えて反応を止め、減圧下溶媒を留去した。残渣に酢酸エチルおよび水を加えて、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/4) により精製して、標記化合

物 146. 5 mg (収率 96%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.29 (d, 1H,  $J = 2.2$  Hz), 6.28 (dd, 1H,  $J = 2.9$  Hz, 2.2 Hz), 6.00 (d, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 5.24 (br s, 1H), 4.30 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 4.28 (d, 1H,  $J = 11.7$  Hz), 2.62 (t, 2H,  $J = 8.1$  Hz), 2.21-2.13 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.08-1.99 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.86-1.72 (m, 2H), 0.87 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 3442, 2975, 1739, 1680, 1600, 1510, 1462, 1383, 1368, 1248, 1043。

マスペクトル (FAB $^+$ ),  $m/z$  : 290 ( $(\text{M}+\text{Na})^+$ ), 268 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(参考例 18)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - エチル - 4 - (5 - ヨードフラン - 2 - イル) ブタン

参考例 17 で得られた (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - エチル - 4 - (フラン - 2 - イル) ブタンをクロロホルム (5.4 ml) に溶解し、ピリジン 0.22 ml (2.73 mmol) およびヨウ素 278 mg (1.10 mmol) を加え、60℃で8時間攪拌した。冷却後、反応液に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応を止め、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/4 ~ 1/6) により精製して、粗生成物 151 mg を得、分取用逆層 HPLC カラム [TSK-GEL ODS-80Ts (2.0 cm  $\times$  25 cm)、東ソー社製、溶出溶媒: アセトニトリル/水 = 60/40] で精製して、標記化合物 74.0 mg (収率 35%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.42 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.95 (d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 5.23 (m, 1H), 4.27 (s, 2H), 2.64 (t, 2H,  $J = 8.4$  Hz), 2.18-2.12 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.05-1.97 (m, 1H), 1.95 (s, 3H),

1.81-1.76 (m, 2H), 0.87 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

IR スペクトル,  $\nu_{\max}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 3442, 2976, 1740, 1681, 1598, 1511, 1462, 1383, 1368, 1246, 1105, 1043。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 416 ( $(\text{M}+\text{Na})^+$ ), 394 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(参考例 19)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン

(19a) (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒石酸塩

参考例 11 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 17.9 g (86.0 mmol) をテトラヒドロフラン (250 ml) およびメタノール (125 ml) の混合液に溶解し、5 規定水酸化カリウム水溶液 (125 ml) を加え、4 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をエタノール (260 ml) に溶解し、D - ( - ) - 酒石酸塩 6.45 g (43.0 mmol) を加えて 2 時間攪拌した後、析出した結晶をろ取して粗結晶 20.67 g を得た。粗結晶 18.65 g をエタノール (370 ml) と水 (37 ml) の混合溶媒から再結晶し、得られた結晶を再度エタノール (300 ml) と水 (30 ml) の混合溶媒から再結晶し、さらに得られた結晶を再度エタノール (240 ml) と水 (24 ml) の混合溶媒から再結晶して、無色鱗片状晶として標記化合物 10.50 g (収率 53%) を得た。

得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒石酸塩 41.4 mg (0.16 mmol) を塩化メチレン (1.6 ml) に懸濁し、ジ-tert-ブチルジカルボナート 0.1758 g (0.81 mmol)、トリエチルアミン



0.225 ml (1.62 mmol) および 4-ジメチルアミノピリジン 2.0 mg (0.016 mmol) を加え、室温で 30 分間攪拌した。水を加え、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=3/2~2/1)により精製して、(4R)-4-メチル-4-[2-(1-メチルピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン 17.7 mg (収率 53%) を得た。

得られた (4R)-4-メチル-4-[2-(1-メチルピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オンは、参考例 11 に準じて、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralCel 0J (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n-ヘキサン/2-プロパノール=70/30、流速: 1.0 ml/min] により光学純度を決定した。

先に溶出されるもの (12.49 分) が 4S 体であり、後から溶出されるもの (15.48 分) が 4R 体であり、光学純度は 99.7% ee であることを確認した。

これにより、先に得られた (2R)-2-アミノ-2-メチル-4-(1-メチルピロール-2-イル)ブタン-1-オール 1/2 D-(-)-酒石酸塩の光学純度は 99.7% 以上であることを確認した。

融点: 198-199°C。

旋光度,  $[\alpha]_D = +$  ( $c = 1.00$ ,  $H_2O$ )。

$^1H$  NMR スペクトル ( $CD_3OD$ , 400 MHz),  $\delta$ : 6.54 (t, 1H,  $J = 2.3$  Hz), 5.91 (dd, 1H,  $J = 3.7$  Hz, 2.3 Hz), 5.82 (br d, 1H,  $J = 3.7$  Hz), 4.32 (s, 1H), 3.61 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 3.55 (s, 3H), 3.54 (d, 1H,  $J = 11.3$  Hz), 2.69-2.57 (m, 2H), 1.97 (ddd, 1H,  $J = 13.8$  Hz, 9.4 Hz, 7.6 Hz), 1.88 (ddd, 1H,  $J = 13.8$  Hz, 11.0 Hz, 6.3 Hz), 1.28 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{max}$   $cm^{-1}$  (KBr): 3480, 3430, 2926, 2634, 2545, 1586, 1516, 1389, 1359, 1309, 1291, 1105, 1039, 710, 690。

マスマスペクトル (FAB<sup>+</sup>),  $m/z$ : 183 ( $(M+H)^+$ ; free 体)。

元素分析値 ( $C_{10}H_{18}N_2O \cdot 1/2C_4H_6O_6$  として%),

計算値 : C : 56.01, H : 8.23, N : 10.89。

実測値 : C : 55.81, H : 8.22, N : 10.89。

(19b) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン

参考例(19a)で得られた(2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒石酸塩 3.98 g (15.5 mmol) を塩化メチレン (50 ml) および水 (12.5 ml) の混合液に懸濁し、水酸化ナトリウム水溶液 (9.7% 水酸化ナトリウム 3.20 g を水 12.5 ml に溶解) を加え、室温で20分間攪拌した。反応液を塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣を塩化メチレン (78 ml) に溶解し、トリエチルアミン 21.5 ml (154.7 mmol)、無水酢酸 7.3 ml (77.4 mmol) および4 - ジメチルアミノピリジン 0.1893 g (1.55 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した後、メタノールを加えて反応を止め、減圧下溶媒を留去した。残渣に酢酸エチルおよび水を加えて、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル) により精製して、標記化合物 4.23 g (収率定量的) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.54 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 6.04 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 5.88 (d, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.33 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 4.20 (d, 1H,  $J = 11.2$  Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.89 (m, 4H), 1.38 (s, 3H)。

マスマススペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 267 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ ), 266 ( $\text{M}^{+\cdot}$ )。

(参考例 20)

ヨウ化 (1 - エチルピロール - 2 - イル) メチルトリフェニルホスホニウ

ム塩

1-エチルピロール 10.0 g (105 mmol) に、35%ホルムアルデヒド水溶液 9 ml (105 mmol) とジメチルアミン塩酸塩 9.0 g (110 mmol) の混合物を、氷冷撹拌下、1時間30分間かけて加え、室温で6時間撹拌した。反応液に10%水酸化ナトリウム水溶液 (150 ml) を加え、エーテルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール=9/1)により精製して、2-(N, N-ジメチルアミノメチル)-1-エチルピロール 15.6 g (収率 97%)を得た。

2-(N, N-ジメチルアミノメチル)-1-エチルピロール 15.6 g (102 mmol) をエタノール (150 ml) に溶解し、氷冷下、ヨウ化メチル 7.7 ml (124 mmol) を加え、室温で3時間撹拌した。反応液に酢酸エチル (150 ml) を加え、析出した結晶をろ取り、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して、ヨウ化 (1-エチルピロール-2-イル) メチルトリメチルアンモニウム塩 20 g (収率 66%)を得た。

ヨウ化 (1-エチルピロール-2-イル) メチルトリメチルアンモニウム塩 20 g (68.0 mmol) をアセトニトリル (200 ml) に懸濁し、トリフェニルホスフィン 22.0 g (83.9 mmol) を加え、80℃で9時間撹拌した。冷却後、減圧下、約1/2に濃縮し、酢酸エチル (100 ml) を加え、析出した結晶をろ取り、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 27.5 g (収率 81%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.94-7.89 (m, 3H), 7.78-7.71 (m, 6H), 7.64-7.57 (m, 6H), 6.82-6.79 (m, 1H), 5.96-5.92 (m, 1H), 5.51-5.47 (m, 1H), 5.10 (d, 2H, J = 13.9Hz), 3.35 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 0.96 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(参考例 21)

(2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 3 - ブテン

参考例 20 で得られたよう化 (1 - エチルピロール - 2 - イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩 19.8 g (39.8 mmol) をテトラヒドロフラン (100 ml) に懸濁し、氷冷攪拌下、t - ブトキシカリウム 4.47 g (39.8 mmol) をテトラヒドロフラン (70 ml) に溶解した溶液を 30 分間かけて加え、さらに氷冷下 1 時間 30 分間攪拌した。ついで、参考例 (2b) で得られた (2S) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 3 - n - ヘキサノイルオキシ - 2 - メチル - 1 - プロパナール 10 g (33.2 mmol) をテトラヒドロフラン (50 ml) に溶解した溶液を 30 分間かけて加え、氷冷下 1 時間 30 分間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、液温を室温に戻し、減圧下濃縮し、水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 4/1) により精製して、標記化合物 11.7 g (収率 90%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.67-6.62 (m, 2H), 6.42-6.36 (m, 1H), 6.31-6.26 (m, 3H), 6.13-6.08 (m, 2H), 6.02-5.96 (m, 1H), 5.63-5.58 (m, 1H), 4.35-4.08 (m, 4H), 3.96-3.86 (m, 4H), 2.85-2.81 (m, 4H), 1.67-1.58 (m, 4H), 1.48-1.24 (m, 38H), 0.93-0.86 (m, 6H)。

#### (参考例 22)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) エチニル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

参考例 21 で得られた (2R) - 2 - t - ブトキシカルボニルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) - 1 - n - ヘキサノイルオキシ - 3 - ブテン 11.7 g (29.8 mmol) をテトラヒドロフラン (40 ml) およびメタノール (40 ml) の混合液に溶解し、2 規定水酸化ナ

トリウム水溶液 40 ml を加え、室温で 1 時間 30 分間攪拌した。反応液に酢酸 1.5 ml を加えて反応を止め、反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、粗生成物 8.7 g を得た。粗生成物をテトラヒドロフラン (100 ml) に溶解し、t-ブトキシカリウム 4.0 g (35.6 mmol) をテトラヒドロフラン (30 ml) に溶解した溶液を氷冷下 10 分間かけて加え、同温度下で 1 時間攪拌した。反応液に酢酸 2 ml を加えて中和し、減圧下濃縮して、水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 3/2) により精製して、標記化合物 5.7 g (収率 86%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 6.73-6.65 (m, 2H), 6.52-6.46 (m, 1H), 6.36-6.29 (m, 2H), 6.15-6.10 (m, 2H), 6.05-5.97 (m, 2H), 5.69-5.65 (m, 2H), 4.31-4.09 (m, 4H), 3.97-3.83 (m, 4H), 1.60-1.53 (m, 6H), 1.39-1.31 (m, 6H)。

(参考例 23)

(4R) - 4 - メチル - 4 - [ 2 - ( 1 - エチルピロール - 2 - イル ) エチル ] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン

10%パラジウム-炭素 (50%含水) 500 mg をエタノール (10 ml) に懸濁し、参考例 22 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [ 2 - ( 1 - エチルピロール - 2 - イル ) エチル ] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 5.7 g (25.9 mmol) をエタノール (50 ml) に溶解した溶液を加え、水素雰囲気下、室温で 1 時間攪拌した。反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過した後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 3/7) により精製して、標記化合物 5.0 g (収率 87%) を得た。

得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オンは、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralPak 0J (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n - ヘキサン / 2 - プロパノール = 70 / 30、流速: 1.0 ml / min] により光学純度を決定した。

先に溶出されるもの (7.5 分) が 4S 体であり、後から溶出されるもの (8.3 分) が 4R 体であり、光学純度は 83.7% ee であることを確認した。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 6.66-6.63 (m, 1H), 6.10-6.07 (m, 1H), 5.89-5.86 (m, 1H), 5.00 (br s, 1H), 4.15 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 4.08 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 3.84 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 2.67-2.61 (m, 2H), 1.99-1.92 (m, 2H), 1.43 (s, 3H), 1.87 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

#### (参考例 24)

(2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン

(24a) (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1 / 2 D - (-) - 酒石酸塩

参考例 23 で得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 4.9 g (22.0 mmol) をテトラヒドロフラン (80 ml) およびメタノール (40 ml) の混合液に溶解し、5.5 規定水酸化カリウム水溶液 (40 ml) を加え、4 日間加熱還流した。冷却後、反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をエタノール 200 ml に溶解し、D - (-) - 酒石酸塩 1.59 g (10.5 mmol) をエタノール (20 ml) に溶解した溶液を加えて 4 時間放置した後、析出した粗結晶をエタノール (100 ml) と水 (10 ml) の混合溶媒から再結晶した。得られた結晶を再度エタ

ノール (50 ml) と水 (5 ml) の混合溶媒から再結晶し、無色板状晶として標記化合物 2.8 g (収率 37%) を得た。

得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒石酸塩 55.5 mg (0.16 mmol) を塩化メチレン (1.6 ml) に懸濁し、ジ-tert-ブチルジカルボナート 0.17 g (0.78 mmol)、トリエチルアミン 0.22 ml (1.58 mmol) および 4 - ジメチルアミノピリジン 3.0 mg (0.025 mmol) を加え、室温で 20 分間攪拌した。水を加え、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) により精製して、(4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 - オン 18.0 mg (収率 58%) を得た。

得られた (4R) - 4 - メチル - 4 - [2 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) エチル] - 1, 3 - オキサゾリジン - 2 -オンは、分析用光学活性 HPLC カラム [ChiralPak 0J (0.46 cm × 25 cm)、ダイセル社製、溶出溶媒: n-ヘキサン/2-プロパノール = 70/30、流速: 1.0 ml/min] により光学純度を決定し、99.9% ee であることを確認した。

これにより、先に得られた (2R) - 2 - メチル - 2 - アミノ - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒石酸塩の光学純度は 99.9% 以上であることを確認した。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (DMSO-d<sub>6</sub>, 400MHz), δ : 6.58-6.54 (m, 1H), 5.93-5.89 (m, 1H), 5.79-5.76 (m, 1H), 4.27 (s, 1H), 3.85 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 3.68 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.62-2.56 (m, 2H), 1.99-1.82 (m, 2H), 1.29 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 1.27 (s, 3H)。

(24b) (2R) - 1 - アセトキシ - 2 - アセチルアミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン

参考例 (24a) で得られた (2R) - 2 - アミノ - 2 - メチル - 4 - (1 - エチルピロール - 2 - イル) ブタン - 1 - オール 1/2 D - ( - ) - 酒

石炭酸塩 2.7 g (7.80 mmol) を塩化メチレン (30 ml) に溶解し、トリエチルアミン 17.0 ml (122 mmol)、無水酢酸 7.6 ml (80.4 mmol) および 4-ジメチルアミノピリジン 20 mg (0.16 mmol) を加え、室温で 3 時間 30 分間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下濃縮乾固し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル) により精製して、標記化合物 2.2 g (収率 96%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz),  $\delta$  : 6.62-6.59 (m, 1H), 6.09-6.06 (m, 1H), 5.89-5.87 (m, 1H), 5.41 (br s, 1H), 4.34 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 4.21 (d, 1H,  $J = 11.0$  Hz), 3.85 (q, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.18 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 1.98-1.93 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.38 (s, 3H), 1.37 (t, 3H,  $J = 7.3$  Hz)。

(参考例 25)

ヨウ化 (1-*t*-ブトキシカルボニルピロール-2-イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩

ピロール 2.72 g (40.47 mmol) に、35%ホルムアルデヒド水溶液 3.2 ml (40.7 mmol) とジメチルアミン塩酸塩 3.44 g (42.2 mmol) の混合物を、室温攪拌下、20 分間かけて加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液に 10%水酸化ナトリウム水溶液 (18 ml) を加え、塩化メチレンで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 塩化メチレン/メタノール = 10/1) により精製して、2-(N, N-ジメチルアミノメチル) ピロール 4.55 g (収率定量的) を得た。

2-(N, N-ジメチルアミノメチル) ピロール 4.54 g (40.41 mmol) をエタノール (40 ml) に溶解し、氷冷下、ヨウ化メチル 3.



0.5 ml (49.0 mmol) を加え、室温で7時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、析出した結晶をろ取り、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して、ヨウ化 (ピロール-2-イル) メチルトリメチルアンモニウム塩 7.59 g (収率 71%) を得た。

ヨウ化 (ピロール-2-イル) メチルトリメチルアンモニウム塩 7.59 g (28.52 mmol) をアセトニトリル (60 ml) に懸濁し、トリフェニルホスフィン 8.98 g (34.2 mmol) を加え、80℃で6時間攪拌した。冷却後、減圧下、約 1/2 に濃縮し、酢酸エチル (100 ml) を加え、析出した結晶をろ取り、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、ヨウ化 (ピロール-2-イル) メチルトリメチルホスホニウム塩 12.33 g (収率 92%) を得た。

ヨウ化 (ピロール-2-イル) メチルトリメチルホスホニウム塩 12.30 g (26.21 mmol) をアセトニトリル (115 ml) に懸濁し、ジ-*t*-ブチルジカルボナート 7.61 g (34.87 mmol) および 4-ジメチルアミノピリジン 0.16 g (1.31 mmol) を加え、室温で24時間攪拌した。減圧下濃縮し、酢酸エチル (50 ml) および塩化メチレン (4 ml) を加え、析出した結晶をろ取り、酢酸エチルで洗浄し、減圧下乾燥して、標記化合物 14.02 g (収率 94%) を得た。

<sup>1</sup>H NMR スペクトル (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz), δ : 7.82-7.78 (m, 3H), 7.68-7.58 (m, 12H), 7.09-7.07 (m, 1H), 6.42-6.39 (m, 1H), 6.11 (t, 1H, J = 3.7 Hz), 5.68 (d, 2H, J = 13.2 Hz), 1.29 (s, 3H)。

#### (参考例 26)

(2R)-2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(1-*t*-ブトキシカルボニルピロール-2-イル)-1-*n*-ヘキサノイルオキシ-3-ブテン

参考例 25 で得られたヨウ化 (1-*t*-ブトキシカルボニルピロール-2-イル) メチルトリフェニルホスホニウム塩 3.30 g (5.80 mmol)

1) をテトラヒドロフラン (60 ml) に懸濁し、氷冷攪拌下、*t*-ブトキシカルリウム 0.65 g (5.8 mmol) をテトラヒドロフラン (5.8 ml) に溶解した溶液を加え、氷冷下 15 分攪拌した。ついで、参考例 (2b) で得られた (2S)-2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-3-*n*-ヘキサノイルオキシ-2-メチル-1-プロパナール 1.46 g (4.83 mmol) をテトラヒドロフラン (3 ml) に溶解した溶液を加え、氷冷下 1 時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を止め、液温を室温に戻し、水および酢酸エチルを加え、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 5/1) により精製して、標記化合物 2.12 g (収率 94%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.25-7.20 (m, 計 2H), 7.11 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 6.61 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 6.39-6.24 (m, 計 2H), 6.18-6.08 (m, 計 2H), 6.08 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 5.64 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 4.92-4.75 (m, 計 2H), 4.34-4.23 (m, 計 2H), 4.22-4.16 (m, 計 2H), 2.38-2.29 (m, 計 4H), 1.69-1.20 (m, 計 54H), 0.94-0.82 (m, 計 6H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ) : 3445, 2981, 2934, 1734, 1495, 1457, 1393, 1370, 1333, 1252, 1163, 1123, 1066。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 465 ( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

#### (参考例 27)

(4R)-4-メチル-4-[2-(ピロール-2-イル)エテニル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン

参考例 26 で得られた (2R)-2-*t*-ブトキシカルボニルアミノ-2-メチル-4-(1-*t*-ブトキシカルボニルピロール-2-イル)-1-*n*-ヘキサノイルオキシ-3-ブテン 1.78 g (3.82 mmol) をテトラヒドロフラン (20 ml) およびメタノール (20 ml) の混合液に溶

解し、1規定水酸化ナトリウム水溶液20mlを加え、室温で1時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去して、粗生成物を得た。得られた粗生成物をテトラヒドロフラン(60ml)に溶解し、*t*-ブトキシカリウム0.557g(4.96mmol)を加え、室温で1時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=2/1)により精製して、標記化合物0.259g(収率35%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 8.69-8.22 (m, 計 2H), 6.88-6.76 (m, 計 2H), 6.48 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 6.34 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 6.39-6.18 (m, 計 4H), 5.82 (d, 1H,  $J = 16.1$  Hz), 5.47 (br s, 1H), 5.37 (d, 1H,  $J = 12.5$  Hz), 5.16 (br s, 1H), 4.40 (d, 計 2H,  $J = 8.8$  Hz), 4.19 (d, 計 2H,  $J = 8.8$  Hz), 1.59 (s, 3H), 1.55 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ): 3467, 2976, 2929, 1759, 1637, 1477, 1455, 1373, 1280, 1165, 1041, 954, 909。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 192 ( $\text{M}^+$ )。

#### (参考例 28)

(4R)-4-メチル-4-[2-(ピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン

参考例 27 で得られた (4R)-4-メチル-4-[2-(ピロール-2-イル)エチル]-1,3-オキサゾリジン-2-オン 0.259g (1.35mmol) をメタノール (6ml) に溶解し、10%パラジウム-炭素 (50%含水) 26mg を加え、水素雰囲気下、室温で30分間攪拌した。反応液中のパラジウム-炭素をセライトろ過した後、ろ液を減圧下留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=2

／1)により精製して、標記化合物0.238g(収率91%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 8.41-8.15 (m, 1H), 6.73-6.68 (m, 1H), 6.17-6.10 (m, 1H), 5.96-5.90 (m, 1H), 5.75 (br s, 1H), 4.12 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 4.05 (d, 1H,  $J = 8.8$  Hz), 2.76-2.61 (m 2H), 2.00-1.83 (m, 2H), 1.37 (s, 3H)。

IR スペクトル,  $\nu_{\text{max}}$   $\text{cm}^{-1}$  ( $\text{CHCl}_3$ ) : 3472, 2980, 2933, 1754, 1571, 1479, 1457, 1400, 1382, 1250, 1162, 1093, 1044, 942。

マスマスペクトル ( $\text{FAB}^+$ ),  $m/z$  : 194 ( $\text{M}^+$ )。

#### (参考例29)

##### 5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イン

水素化ナトリウム2.11g(48.4mmol)を無水テトラヒドロフラン60ml中に懸濁させ、氷冷下、ジエチルホスホノ酢酸 エチルエステル10.84g(48.4mmol)を滴下し、10分間攪拌した。次いで4-フルオロベンズアルデヒド5.00g(40.3mmol)を無水テトラヒドロフラン60mlに溶解した溶液を同温にて滴下した。反応液を3時間攪拌した後、氷水中150mlに注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=10/1~3/1)にて精製を行い、4-フルオロ桂皮酸 エチルエステルを無色油状物として、6.69g(86%)得た。

このエステル6.52g(33.6mmol)を酢酸エチル100ml中に溶解し、5%ロジウム/アルミナ1.30gを加え、水素雰囲気下、室温にて8時間攪拌した。反応混合物をセライトろ過し、濾液を減圧濃縮し、残渣を無水テトラヒドロフラン30ml中に溶解した。この溶液を氷冷下、水素化アルミニウムリチウム1.26g(33.2mmol)を無水テトラヒドロフラン60mlに懸濁させたものに滴下した。反応混合物を同温にて30分間攪拌後、飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え、さらに室温で10分間攪

拌した。混合物をセライトろ過し、ろ液を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝5／1～1／1）にて精製を行い、3-（4-フルオロフェニル）プロパン-1-オールを無色油状物として、4.86 g（95%）得た。

得られた3-（4-フルオロフェニル）プロパン-1-オール4.83 g（31.3 mmol）を塩化メチレン50 ml中に溶解し、氷冷下、トリエチルアミン6.55 ml（47.0 mmol）及びメタンスルホンクロリド2.91 ml（37.6 mmol）を加え、窒素雰囲気下、30分間攪拌した。反応混合物を塩化メチレン50 mlで希釈し、氷冷した10%塩酸、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をアセトン100 ml中に溶解した。次いでヨウ化ナトリウム9.39 g（62.6 mmol）を加え、窒素雰囲気下、50℃にて2時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル250 mlで希釈後、10%チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝5／1～2／1）にて精製を行い、3-（4-フルオロフェニル）-1-ヨードプロパンを淡黄色油状物として、7.12 g（86%）得た。

ヘキサメチルホスホラミド20 ml中にナトリウムアセチリド（18%キシレン懸濁液）50 mlを加え、氷冷下、先に得られた4-フルオロフェニル-1-ヨードプロパン7.00 g（26.5 mmol）を無水ジメチルホルムアミド20 mlに溶解した溶液を加えた。反応混合物を室温にて、2時間攪拌した。氷冷下に氷水を注意深く注ぎ、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン）にて精製を行い、標記化合物を無色油状物として、2.67 g（6

2 %) 得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.14 (m, 2H), 6.97 (m, 2H), 2.71 (t, 2H,  $J = 7.5$  Hz), 2.19 (m, 2H), 1.99 (t, 1H,  $J = 2.6$  Hz), 1.82 (m, 2H)。  
マスマスペクトル (EI),  $m/z$  : 162 ( $\text{M}^+$ )。

(参考例 30)

5-フェニルペント-1-イン

参考例 29 と同様に、3-フェニル-1-ヨードプロパン及びナトリウムアセチリドを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.32-7.26 (m, 2H), 7.23-7.16 (m, 3H), 2.74 (t, 2H,  $J = 7.6$  Hz), 2.21 (dt, 2H,  $J = 7.6$  Hz, 2.8 Hz), 1.99 (t, 1H,  $J = 2.8$  Hz), 1.89-1.81 (m, 2H)。  
マスマスペクトル (EI),  $m/z$  : 144 ( $\text{M}^+$ )。

(参考例 31)

5-(4-クロロフェニル)ペント-1-イン

参考例 29 と同様に、3-(4-クロロフェニル)-1-ヨードプロパン及びナトリウムアセチリドを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.26-7.23 (m, 2H), 7.13-7.11 (m, 2H), 2.71 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.19 (dt, 2H,  $J = 7.3$  Hz, 2.9 Hz), 1.99 (t, 1H,  $J = 2.9$  Hz), 1.85-1.78 (m, 2H)。

(参考例 32)

5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ペント-1-イン

参考例 29 と同様に、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ヨードプロパン及びナトリウムアセチリドを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.46-7.37 (m, 4H), 2.81 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.22 (dt, 2H,  $J = 7.3$  Hz, 2.9 Hz), 2.01 (t, 1H,  $J = 2.9$  Hz),

1.90-1.83 (m, 2H)。

(参考例 3 3)

5-シクロヘキシルペント-1-イン

参考例 2 9 と同様に、3-シクロヘキシル-1-ヨードプロパン及びナトリウムアセチリドを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 2.16 (dt, 2H,  $J = 7.2$  Hz, 2.8, Hz), 1.94 (t, 1H,  $J = 2.8$  Hz), 1.59-1.48 (m, 2H), 1.38-0.75 (m, 13H)。マスペクトル (EI),  $m/z$  : 150 ( $\text{M}^+$ )。

(参考例 3 4)

4-シクロヘキシルオキシブト-1-イン

シクロヘキサノン 3.2 ml (0.31 mol) を無水塩化メチレン 950 ml に溶解し、1, 3-プロパンジオール 33.5 ml (0.46 mol)、オルトギ酸トリエチル 51.5 ml (0.31 mol)、塩化ジルコニウム 1.44 g (6.18 mmol) を加え、窒素雰囲気下、室温で 1 時間攪拌した。氷冷した 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 1.5 l を加え、塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を水で洗浄した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣を減圧蒸留で精製し、シクロヘキサノン トリメチレン ケタール 26.8 g (55%) を得た。

塩化ジルコニウム 24.9 g (0.11 mol) をテトラヒドロフラン 500 ml に懸濁し、水素化ホウ素ナトリウム 20.5 g (0.54 mol) を、窒素雰囲気下、ゆっくりと加え、室温で 20 分攪拌した。この反応液に、先に得られたシクロヘキサノン トリメチレン ケタール 16.9 g (0.11 mol) を含むテトラヒドロフラン 170 ml 溶液を窒素雰囲気下、氷冷下滴下し、滴下終了後、室温で一昼夜攪拌した。氷冷下、氷冷した 2 規定塩酸 600 ml を加えて、反応を終了させ、テトラヒドロフランを減圧下濃縮した。残った水相を、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水で

洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝10／1～5／2）により精製し、3-シクロヘキシルオキシプロパン-1-オール13.4g（78%）を得た。

得られた3-シクロヘキシルオキシプロパン-1-オール11.5g（72.9mmol）を塩化メチレン240mlに溶解し、氷冷下、モレキュラーシーブ4A58gおよび重クロム酸ピリジニウム23.8g（0.11mol）を加え、窒素雰囲気下、1時間40分間攪拌した。反応液にエーテルを加え、セライトろ過した。ろ物をエーテルで洗浄後、ろ液を合わせ、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝20／1～10／1）により精製し、粗製の3-シクロヘキシルオキシプロピオンアルデヒド8.60gを得た。

四臭化炭素36.5g（0.11mol）を塩化メチレン120mlに溶解し、トリフェニルホスフィン57.7g（0.22mol）を塩化メチレン120mlに溶解した溶液を窒素雰囲気下、氷冷下に加え、5分間攪拌した。この反応液に、先に得られた粗製の3-シクロヘキシルオキシプロピオンアルデヒド8.60gを塩化メチレン90mlに溶解した溶液を窒素雰囲気下、氷冷下に加え、同温度で25分間攪拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄した。塩化メチレン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝100／1～33／1）により精製し、4-シクロヘキシルオキシ-1,1-ジプロモブト-1-エン12.6g（55%、2工程）を得た。

得られた4-シクロヘキシルオキシ-1,1-ジプロモブト-1-エン12.6g（40.4mmol）をテトラヒドロフラン130mlに溶解し、窒素雰囲気下、-78℃で、n-ブチルリチウムのヘキサン（1.5mol／l）溶液54ml（81.0mmol）を加え、-78℃で1時間攪拌し、その後ゆっくりと室温まで昇温した。室温で50分間攪拌した後、氷冷下、



水を加えて反応を終了させた。エーテルで抽出し、エーテル層を飽和食塩水で洗浄した。ジエチルエーテル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝100／1～50／1）により精製し、標記化合物4.35 g（71%）を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 3.59 (t, 2H,  $J = 7.2$  Hz), 3.32-3.23 (m, 1H), 2.45 (dt, 2H,  $J = 7.2$  Hz, 2.8 Hz), 1.97 (t, 1H,  $J = 2.8$  Hz), 1.95-1.85 (m, 2H), 1.81-1.67 (m, 2H), 1.58-1.48 (m, 1H), 1.36-1.13 (m, 5H)。マスペクトル (EI),  $m/z$  : 153( $(\text{M}+\text{H})^+$ )。

(参考例 35)

4-(4-フルオロフェニルオキシ)ブト-1-イン

4-フルオロフェノール 5.00 g (44.6 mmol)、3-ブチン-1-オール 3.38 ml (44.6 mmol)、トリフェニルホスフィン 17.5 g (66.9 mmol) をテトラヒドロフラン 100 ml に溶解し、氷冷下、アゾジカルボン酸 ジエチルエステル 11.7 g (66.9 mmol) を加え、室温で 18 時間攪拌した。溶媒を減圧濃縮し、ヘキサン 200 ml 及び酢酸エチル 20 ml を加え、析出した沈殿を濾取して取り除き、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をフラッシュシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出溶媒：ヘキサン）にて精製し、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.02-6.94 (m, 2H), 6.90-6.82 (m, 2H), 4.07 (t, 2H,  $J = 7.0$  Hz), 2.70-2.63 (m, 2H), 2.05 (t, 1H,  $J = 2.7$  Hz)。

マスペクトル (EI),  $m/z$  : 164( $\text{M}^+$ )。

(参考例 36)

4-フェニルオキシブト-1-イン

参考例 35 と同様に、フェノールと 3-ブチン-1-オールを用いて、標

記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.29 (dd, 2H,  $J = 8.8$  Hz, 7.3 Hz), 6.96 (t, 1H,  $J = 7.3$  Hz), 6.92 (d, 2H,  $J = 8.8$  Hz), 4.11 (t, 2H,  $J = 6.6$  Hz), 2.68 (dt, 2H,  $J = 6.6$  Hz, 2.2 Hz), 2.04 (t, 1H,  $J = 2.2$  Hz)。

(参考例 37)

3- (3, 4-ジメチルフェニルオキシ) -1-プロピン

参考例 35 と同様に、3, 4-ジメチルフェノールとプロパルギルアルコールを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.04 (d, 1H,  $J = 8.0$  Hz), 6.78 (d, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 6.72 (dd, 1H,  $J = 8.0$  Hz, 2.4 Hz), 4.65 (d, 2H,  $J = 2.4$  Hz), 2.49 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 2.24 (s, 3H), 2.20 (s, 3H)。

マススペクトル (EI),  $m/z$  : 160 ( $\text{M}^+$ )。

(参考例 38)

3- (4-メチルフェニルオキシ) -1-プロピン

参考例 35 と同様に、4-メチルフェノールとプロパルギルアルコールを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.10 (d, 2H,  $J = 8.4$  Hz), 6.88 (d, 2H,  $J = 8.4$  Hz), 4.67 (d, 2H,  $J = 2.4$  Hz), 2.50 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 2.29 (s, 3H)。

マススペクトル (EI),  $m/z$  : 146 ( $\text{M}^+$ )。

(参考例 39)

3- (4-メチルチオフェニルオキシ) -1-プロピン

参考例 35 と同様に、4-メチルチオフェノールとプロパルギルアルコールを用いて、標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.27 (d, 2H,  $J = 8.9$  Hz), 6.9

3 (d, 2H,  $J = 8.9$  Hz), 4.68 (d, 2H,  $J = 2.4$  Hz), 2.52 (t, 1H,  $J = 2.4$  Hz), 2.45 (s, 3H)。

マススペクトル (EI),  $m/z$ : 178 ( $M^+$ )。

(参考例 40)

2-〔4-(シクロヘキシルメトキシ)フェニル〕-4, 4, 5, 5-テトラメチル-〔1, 3, 2〕-ジオキサボロラン

4-ブロモフェノール 6.0 g (34.7 mmol)、シクロヘキシルメチルフェノール 4.3 ml (34.7 mmol)、およびトリフェニルホスフィン 9.1 g (34.7 mmol)のテトラヒドロフラン (100 ml) 溶液に、0℃でアゾジカルボン酸 ジエチルエステル 40%トルエン溶液 15.1 ml (34.7 mmol)をゆっくり加えたのち、反応液を室温で3時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去して、得られた残渣にヘキサンを加えた。ろ過後、再び減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/20)により精製して1-ブロモ-4-(シクロヘキシルメトキシ)ベンゼン 5.1 g (収率 54%)を得た。1-ブロモ-4-(シクロヘキシルメトキシ)ベンゼン 3.0 g (11.1 mmol)、ビス(ピナコラート)ジボラン 3.4 g (13.3 mmol)、塩化パラジウム-ジフェニルホスフィノフェロセン錯体 450 mg (0.551 mmol)、および酢酸カリウム 2.2 g (22.2 mmol)のジメチルスルホキシド (50 ml) 溶液を80℃で30分間攪拌した後、反応液を酢酸エチルで希釈した。これに活性炭を加え、室温で30分間攪拌した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/100)により精製して、標記化合物 1.72 g (収率 49%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$ : 7.73 (d, 2H,  $J = 8.5$  Hz), 6.88 (d, 2H,  $J = 8.5$  Hz), 3.77 (d, 2H,  $J = 5.9$  Hz), 1.93-1.64 (m, 5H), 1.33 (s, 12H), 1.33-1.14 (m, 4H), 1.12-0.97 (m, 2H)。

## (参考例 4 1)

2-[3-(2-シクロヘキシルエトキシ)フェニル]-4,4,5,5-テトラメチル-[1,3,2]-ジオキサボロラン

3-ブロモフェノール 15.0 g (86.7 mmol)、2-シクロヘキシルエチルフェノール 12.0 ml (86.7 mmol)、およびトリフェニルホスフィン 23.0 g (86.7 mmol)のテトラヒドロフラン (200 ml) 溶液に、0℃でアゾジカルボン酸 ジエチルエステル 40%トルエン溶液 38.0 ml (86.7 mmol)をゆっくり加えたのち、反応液を室温で7時間攪拌した。反応終了後、減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にヘキサンを加えた。ろ過後、再び減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/100) により精製して1-ブロモ-3-(2-シクロヘキシルエトキシ)ベンゼン 23.0 g (収率94%)を得た。1-ブロモ-3-(2-シクロヘキシルエトキシ)ベンゼン5.0 g (17.7 mmol)、ビス(ピナコラート)ジボラン 5.4 g (21.2 mmol)、塩化パラジウム-ジフェニルホスフィンオキセン錯体1.40 g (1.77 mmol)、および酢酸カリウム3.5 g (35.4 mmol)のジメチルスルホキシド (80 ml) 溶液を80℃で30分間攪拌した後、反応液を酢酸エチルで希釈した。これに活性炭を加え、室温で30分間攪拌した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/100) により精製して、標記化合物 4.70 g (収率80%)を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.38-7.24 (m, 3H), 7.00 (dd, 1H,  $J = 8.1, 2.9$  Hz), 4.02 (t, 2H,  $J = 6.6$  Hz), 1.81-1.63 (m, 8H), 1.34 (s, 12H), 1.31-1.12 (m, 3H), 1.06-0.88 (m, 2H)。

## (参考例 4 2)

4-フェニルオキシブタン酸クロリド

## (42a) 4-フェニルオキシブタン酸

水素化ナトリウム (60%含量) 2.41 g (60.3 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (60 ml) に懸濁し、窒素雰囲気下、氷冷下でフェノール 5.70 g (60.6 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (30 ml) に溶解した溶液を 20 分間要して加え、室温で 1.5 時間攪拌した。この反応液に  $\gamma$ -ブチロラクトン 5.01 g (58.2 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (30 ml) に溶解した溶液を加え、130℃で 6 時間攪拌した。冷却後、減圧下濃縮し、水を加えて塩化メチレンで抽出し、塩化メチレン層を水洗した。水層に 1 規定塩酸水溶液 (72 ml) を加えて酸性として、酢酸エチルで抽出し、酢酸エチル層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (溶出溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 5/1 ~ 2/1) により精製して、標記化合物 3.58 g (収率 34%) を得た。

$^1\text{H}$  NMR スペクトル ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz),  $\delta$  : 7.30-7.27 (m, 2H), 6.96-6.87 (m, 3H), 4.03 (t, 2H,  $J = 5.9$  Hz), 2.60 (t, 2H,  $J = 7.3$  Hz), 2.16-2.09 (m, 2H)。

## (42b) 4-フェニルオキシブタン酸クロリド

参考例 (42a) で得られた 4-フェニルオキシブタン酸 0.5066 g (2.81 mmol) をベンゼン (5 ml) に溶解し、塩化チオニル 0.42 ml (5.76 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 2  $\mu$ l を加え、80℃で 1 時間攪拌した。冷却後、減圧下濃縮して、標記化合物 0.5556 g (収率 99%) を得た。

## (試験例 1)

ラット HvGR (Host versus Graft Reaction) に対する抑制活性の測定

(1) 2 系統のラット [Lewis (雄、6 週齢、日本チャールス・リバー株式会社) と WKAH/Hkm (雄、7 週齢、日本エスエルシー株式会社)] を使用した。

1群5匹のラット（宿主）を用いた。

## （2）HvGRの誘導

WKAH/HkmラットまたはLewisラットの脾臓から脾臓細胞を単離し、RPMI1640培地（ライフ テクノロジー社製）で $1 \times 10^8$ 個/ml濃度に浮遊した。Lewisラットの両後肢足蹠皮内に、WKAH/HkmラットまたはLewisラットの脾臓細胞浮遊液0.1ml（脾臓細胞数として $1 \times 10^7$ 個）を注射した。

## （3）化合物の投与

化合物は0.5%トラガカント液に懸濁した。懸濁した化合物は、化合物投与群（WKAH/Hkmラット脾臓細胞を注射され、検体を投与されるLewisラット）に、ラットの体重1kg当たり5mlの割合で、1日1回、脾臓細胞注射日から4日間連日でラットに経口投与した。なお、同系群（Lewisラット脾臓細胞を注射されたLewisラット群）と対照群（WKAH/Hkmラット脾臓細胞を注射され、検体を投与されないLewisラット）には、検体の代わりに0.5%トラガカント液を経口投与した。

## （4）HvGRに対する抑制活性の測定方法

各個体の膝窩（popliteal）リンパ節重量から同系群の平均膝窩リンパ節重量を引き（「HvGRによる膝窩リンパ節重量」）、対照群の平均「HvGRによる膝窩リンパ節重量」に対する化合物投与群の各個体の「HvGRによる膝窩リンパ節重量」から抑制率を算出した。化合物の抑制活性は、化合物の投与量と抑制率から最小二乗法を用いて算出したID<sub>50</sub>値（mg/kg）で表示した。

本試験の結果、本発明の化合物は優れた抑制活性を示した。

表 9

化合物	HvGR ID <sub>50</sub> 値 (mg/kg)
実施例 2	0.714
実施例 3	0.116

実施例 9	0. 1 2 0
実施例 1 0	0. 2 7 6
実施例 1 5	0. 3 0 4
実施例 1 9	0. 0 9 7
実施例 2 0	0. 0 8 2
実施例 3 3	0. 0 1 3

---

### (試験例 2)

アジュバント関節炎発症に対する抑制活性の測定

#### (1) アジュバントの調製

*Mycobacterium butyricum*の死菌を流動パラフィンに2mg/mlの割合になるように懸濁し、超音波処理を行い調製した。

#### (2) 被験化合物の調製

被験化合物は0.5%トラガカント液に懸濁または溶解した。

#### (3) アジュバント関節炎の誘導

(1)で調製したアジュバント0.05mlをラット(通常Lewis系)の右後肢足蹠皮内に注射した。なお、通常1群の匹数は5とした。また、アジュバントを注射しない群(正常群)を1群設けた。

#### (4) 化合物の投与

(2)で調製した化合物をラットの体重1kg当たり5mlの割合でアジュバント注射日から1日1回、21日間連日経口投与した。なお、アジュバントを投与した1群(対照群)およびアジュバントを注射しない群には0.5%トラガカント液を投与した。

#### (5) 化合物の発症抑制活性の算出法

最終投与1日後に右後肢の体積を足体積測定装置で測定し、各個体の値から正常群の平均値を引き、その値を腫脹体積とした。対照群の平均腫脹体積に対する化合物を投与された各個体の腫脹体積の割合から抑制率を算出した。

化合物の抑制活性は、化合物の投与量と抑制率から最小二乗法を用いて算出したID<sub>50</sub>値 (mg/kg) で表示した。

本試験の結果、本発明の化合物は優れた抑制活性を示した。

表 10

化合物	ID <sub>50</sub> 値 (mg/kg)
実施例 2	0.0899
実施例 3	0.0774
実施例 19	0.108
実施例 20	0.102
実施例 33	0.0941

(試験例 3)

ラット HvGR (Host versus Graft Reaction) に対する抑制活性の測定

(1) 2系統のラット [Lewis (雄、6週齢、日本チャールス・リバー株式会社) と WKAH/Hkm (雄、7週齢、日本エスエルシー株式会社)] を使用した。1群5匹のラット (宿主) を用いた。

(2) HvGRの誘導

WKAH/HkmラットまたはLewisラットの脾臓から脾臓細胞を単離し、RP MI1640培地 (ライフテクノロジー社製) で濃度  $1 \times 10^8$  個/mlの脾臓細胞浮遊液を作製した。WKAH/Hkmラット脾臓細胞浮遊液 0.1 ml を Lewisラットの両後肢足蹠皮内 (HvGR誘発群)、またはLewisラットの脾臓細胞浮遊液 0.1 ml を Lewisラットの両後肢足蹠皮内 (同系群) に注射した。

(3) 化合物の投与

サイクロスポリン A、タクロリムス、および例示化合物番号：式 Ia-3 にお



ける1-1093の化合物{2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オールである。}のマレイン酸塩(以下、化合物Aと記す)を、0.5%トラガカント液で、それぞれ0.08 mg/5 ml、0.08 mg/5 ml および0.008 mg/5 mlの濃度に懸濁した。

サイクロスポリン A及び化合物A投与群には、サイクロスポリン A懸濁液と化合物A懸濁液を、タクロリムス及び化合物A投与群には、タクロリムス懸濁液と化合物A懸濁液を、それぞれ、体重1 kg当たり5 mlの割合で、1日1回、脾臓細胞注射日から4日間連日でラットに経口投与した。

なお、サイクロスポリン A投与群には、サイクロスポリン A懸濁液と0.5%トラガカント液を、タクロリムス投与群には、タクロリムス懸濁液と0.5%トラガカント液を、化合物A投与群には、化合物A懸濁液と0.5%トラガカント液を、それぞれ、体重1 kg当たり5 mlの割合で、1日1回、脾臓細胞注射日から4日間連日でラットに経口投与した。

また、同系群(Lewisラット脾臓細胞を注射され、化合物を投与されないLewisラット)と対照群(WKAH/Hkmラット脾臓細胞を注射され、化合物を投与されないLewisラット)には、0.5%トラガカント液を経口投与した。

#### (4) HvGRに対する抑制活性の測定方法

各個体の膝窩リンパ節重量から同系群の平均膝窩リンパ節重量を引き(「HvGRによる膝窩リンパ節重量」)、対照群の平均「HvGRによる膝窩リンパ節重量」に対する化合物投与群の各個体の「HvGRによる膝窩リンパ節重量」から抑制率を算出した。

表 11

投与群	HvGR 抑制率 (%)
-----	--------------

サイクロスポリンA投与群	18.7
タクロリムス投与群	25.8
化合物A投与群	16.0
サイクロスポリンA+化合物A投与群	36.1
タクロリムス+化合物A投与群	44.8

---

#### (試験例4)

マウス GvHD (Graft versus Host Disease) に対する抑制活性の測定

(1) 2系統のマウス [BDF1 (雄、6週齢、日本チャールス・リバー株式会社) と C57BL/6 (雄、7週齢、日本チャールス・リバー株式会社)] を使用した。1群5匹のマウス (宿主) を用いた。

#### (2) GvHDの誘導

C57BL/6 マウスまたはBDF1 マウスの脾臓から脾臓細胞を単離し、RPMI 1640培地 (ライフテクノロジー社製) で濃度  $2 \times 10^7$  個/ml の脾臓細胞浮遊液を作製した。C57BL/6 マウス脾臓細胞浮遊液 0.5 ml を BDF1 マウスの尾静脈内 (GvHD 誘発群)、または BDF1 マウスの脾臓細胞浮遊液 0.5 ml を BDF1 マウスの尾静脈内 (同系群) に注射した。

#### (3) 化合物の投与

サイクロスポリン A、タクロリムス、および例示化合物番号: 式Ia-2における1-1093の化合物{2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オールである。}の塩酸塩 (以下、化合物Bと記す) を、0.5%メチルセルロース (MC) 液で、それぞれ0.1 mg/10 ml、0.2 mg/10 ml および0.01 mg/10 mlの濃度に懸濁した。

サイクロスポリン A及び化合物B投与群には、サイクロスポリン A懸濁液と化合物B懸濁液を、タクロリムス及び化合物B投与群には、タクロリムス懸濁液と化合物B懸濁液を、それぞれ、体重1 kg 当たり10 ml の割合で

、1日1回、脾臓細胞注射日から10日間連日でマウスに経口投与した。

なお、サイクロスポリン A投与群には、サイクロスポリン A懸濁液と0.5% MC 液を、タクロリムス投与群には、タクロリムス懸濁液と0.5% MC 液を、化合物B投与群には、化合物B懸濁液と0.5% MC 液を、それぞれ、体重1kg当たり10mlの割合で、1日1回、脾臓細胞注射日から10日間連日でマウスに経口投与した。

また、同系群（BDF1 マウス脾臓細胞を注射され、化合物を投与されないBDF1 マウス）と対照群（C57BL/6 マウス脾臓細胞を注射され、化合物を投与されないBDF1 マウス）には、0.5% MC 液を経口投与した。

#### （4）GvHDに対する抑制活性の測定方法

体重ならびに脾臓重量を測定し、脾臓重量を体重で除法し「GvHDによる体重(g)で補正した脾臓重量(mg)」を算出した。各個体の「GvHDによる体重で補正した脾臓重量」から同系群の平均「GvHDによる体重で補正した脾臓重量」を引き、対照群の平均「GvHDによる体重で補正した脾臓重量」に対する化合物投与群の各個体の「GvHDによる体重で補正した脾臓重量」から抑制率を算出した。

表 12

投与群	GvHD 抑制率 (%)
サイクロスポリンA投与群	12.5
タクロリムス投与群	7.6
化合物B投与群	-2.9
サイクロスポリンA+化合物B投与群	28.4
タクロリムス+化合物B投与群	13.4

## (試験例 5)

マウ皮膚移植に対する抑制活性の測定

(1) 2系統のマウス [C57BL/6N (雌、5 週齢、日本チャールス・リバー株式会社) と BALB/cAnN (雌、5 週齢、日本チャールス・リバー株式会社)] を使用した。1 群 10 匹のマウス (被移植個体) を用いた。

## (2) 皮膚移植手順

C57BL/6N マウスを頸椎脱臼で安楽死させ、皮膚を剥離した。その皮膚を、生検トレパン (MK706、8mm、カイ インダストリー株式会社) を用いて、直径 8mm の大きさに切り取った。次に、アバチンで麻酔した BALB/cAnN マウスの背部に、生検トレパンを用いて、直径 8mm の大きさの傷を付けた。その傷に沿って眼科ハサミを用いて皮膚を除去した。先の C57BL/6N マウスの切り取った皮膚を、BALB/cAnN マウスの除去した部分に移植した。移植した部分は、外科用アロンアルファ (三共株式会社) で固定した。移植した部分には、ソフラチュール (1 枚 (10 cm × 10 cm) 中にフラジオマイシン 10.8 mg 含有、アベンティス ファーマ株式会社) および滅菌ガーゼをあて、くつつく包帯 (S サイズ、スリーエム株式会社) を巻き、その包帯の両端をシルキーテックス (1 号、アルケア株式会社) で固定した。

## (3) 化合物の投与

サイクロスポリン A、タクロリムス、および例示化合物番号：式 Ia-2 における 1-1093 の化合物 {2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル]ブタン-1-オールである。} の塩酸塩 (以下、化合物 B と記す) を、0.5% メチルセルロース (MC) 液で、それぞれ 30 mg / 10 ml、3 mg / 10 ml および 0.1 mg / 10 ml の濃度に懸濁した。

サイクロスポリン A 及び化合物 B 投与群には、サイクロスポリン A と化合物 B を、タクロリムス及び化合物 B 投与群には、タクロリムスと化合物 B をそれぞれの濃度で 0.5% MC 液に懸濁した。それぞれ、体重 1 kg 当たり 10 ml の割合で、移植当日より 1 日 1 回、14 日間経口投与した。

## (4) 移植皮膚片拒絶に対する抑制活性の測定方法

移植後（移植日を0日）6日に、ハサミを用いて皮膚を傷つけないようにくつつく包帯、シルキーテックス、滅菌ガーゼおよびソフラチュールを除去した。翌日より1日1回、移植後20日目まで、移植した皮膚の拒絶の有無を判定した。判定は全てブラインドにより行い、移植皮膚片拒絶日数の中央値を算出した。

表 13

投与群	移植皮膚片拒絶日数中央値（日）
0.5% MC投与群	10.0
サイクロスポリンA投与群	12.0
タクロリムス投与群	11.0
化合物B投与群	15.0
サイクロスポリンA+化合物B投与群	17.5
タクロリムス+化合物B投与群	16.5

## (製剤例1)

## 錠剤

サイクロスポリンA	50.0mg
化合物A	10.0mg
乳糖	113.0mg
トウモロコシデンプン	25.0mg
ステアリン酸マグネシウム	2.0mg

---

 200 mg

上記処方 of 粉末を混合し、打錠機により打錠して、1錠200mgの錠剤とする。

また、上記処方中、化合物Aは、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]ブタン-1-オール マレイン酸塩である。

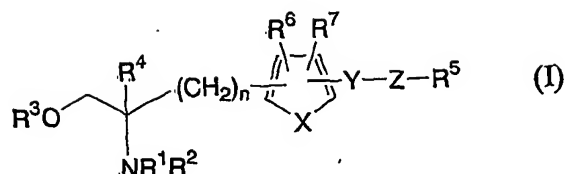
#### [産業上の利用の可能性]

本発明の化合物及び本発明の医薬組成物は、優れた免疫抑制作用を有し、且つ、毒性が低く、さらに本発明の医薬組成物は、該組成物中に含有される免疫抑制剤のいずれの薬理効果をも増強して発揮し、かつ該免疫抑制剤単独では持ちうる副作用も低減させるので、医薬として有用であり、例えば、温血動物（特にヒト）の各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性筋炎、結合組織炎、骨格筋炎、骨関節炎、変形性関節症、皮膚筋炎、強皮症、ベーチェット病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自己免疫性肝炎、再生不良性貧血、特発性血小板減少性紫斑病、自己免疫性溶血性貧血、多発性硬化症、自己免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症群、Wegener肉芽腫、ぶどう膜炎、シェーグレン症候群、特発性間質性肺炎、Goodpasture症候群、サルコイドーシス、アレルギー性肉芽腫性血管炎、気管支喘息、心筋炎、心筋症、大動脈炎症候群、心筋梗塞後症候群、原発性肺高血圧症、微小変化型ネフローゼ、膜性腎症、膜性増殖性腎炎、巣状糸球体硬化症、半月体形成性腎炎、重症筋無力症、炎症性ニューロパチー、アトピー性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、蕁瘡、Sydenham 舞蹈病、硬化症、成人発症糖尿病、インスリン依存性糖尿病、若年性糖尿病、アテローム性動脈硬化症、糸球体腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、劇症肝炎、ウイルス性肝炎、GVHD、接触皮膚炎、敗血症等の自己免疫疾患又はその他免疫関連疾患、さらに、真菌、マイコプラズマ、ウィルス、原虫等の感染症、心不全、心肥大、不整脈、狭心症、心虚血、動脈塞栓、動脈瘤、静脈瘤、血行障害等の循環器系疾患、

アルツハイマー病、痴呆、パーキンソン病、脳卒中、脳梗塞、脳虚血、鬱病、躁鬱病、統合失調症、ハンチントン舞踏病、癲癇、痙攣、多動症、脳炎、髄膜炎、食欲不振および過食等の中枢系疾患、リンパ腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等の各種疾患の予防薬又は治療薬として有用であり、特に、各種臓器移植又は皮膚移植での拒絶反応、全身性エリトマトーデス、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、アトピー性皮膚炎等の自己免疫疾患の予防剤若しくは治療剤として有用である。

## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式 (I):



[式中、

$\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

$\text{R}^3$  は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ基の保護基を示し、

$\text{R}^4$  は、低級アルキル基を示し、

$n$  は、1乃至6の整数を示し、

$\text{X}$  は、酸素原子または式  $\text{N}-\text{D}$  を有する基（式中、 $\text{D}$  は水素原子、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリール基、低級アルキルスルホニル基、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリールスルホニル基又は置換基群  $a$  から選択される基を示す。）を示し、

$\text{Y}$  は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式  $-\text{E}-\text{CH}_2-$  を有する基（式中、 $\text{E}$  は、カルボニル基又は式  $-\text{CH}(\text{OH})-$  を有する基を示す。）、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリーレン基又は置換基群  $a$  から選択される基で1乃至3個置換された  $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリーレン基を示し、

$\text{Z}$  は、単結合、 $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基、又は置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $\text{C}_1-\text{C}_{10}$  アルキレン基を示し、

$\text{R}^5$  は、水素原子、 $\text{C}_3-\text{C}_{10}$  シクロアルキル基、 $\text{C}_6-\text{C}_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複



素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3$  -  $C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6$  -  $C_{10}$  アリール基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 a から選択される基を示し、

置換基群 a は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ - 低級アルキルアミノ基、ジ - 低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

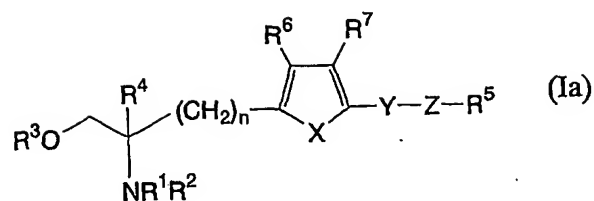
置換基群 b は、 $C_3$  -  $C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6$  -  $C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3$  -  $C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6$  -  $C_{10}$  アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$  が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1$  -  $C_{10}$  アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1$  -  $C_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1$  -  $C_{10}$  アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1$  -  $C_{10}$  アルキレン基を示す。]

を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

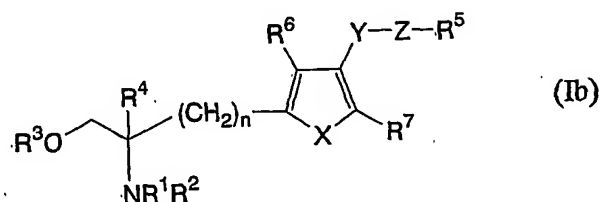
2. 請求の範囲第 1 項において、式 (I) を有する化合物が、式 (I a

):



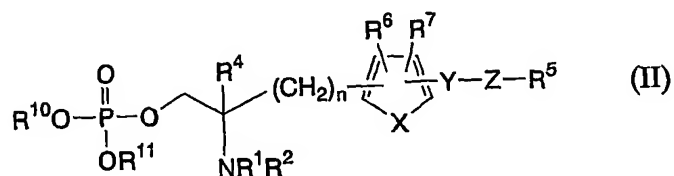
を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

3. 請求の範囲第1項において、式(I)を有する化合物が、式(Ib) ):



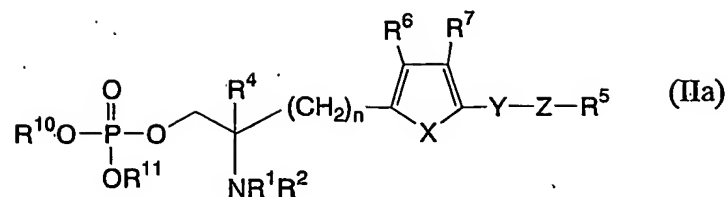
を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

4. 請求の範囲第1項において、式(I)を有する化合物の薬理上許容されるエステルが、式(II):



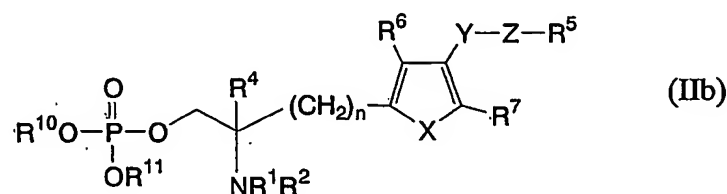
(式中、R<sup>10</sup>及びR<sup>11</sup>は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩。

5. 請求の範囲第4項において、式(II)を有するエステルが、式(IIa):



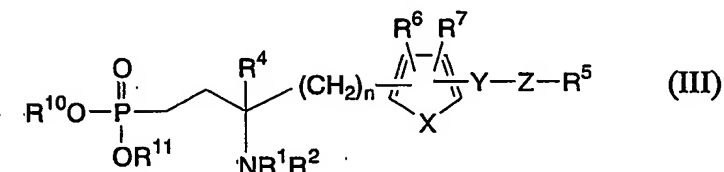
を有する化合物又はその薬理上許容される塩。

6. 請求の範囲第4項において、式 (I I) を有するエステルが、式 (I I b) :



(式中、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。) を有する化合物又はその薬理上許容される塩。

7. 一般式 (I I I) :



[式中、

$R^1$ 及び $R^2$ は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

$R^4$ は、低級アルキル基を示し、

$n$ は、1乃至6の整数を示し、

$X$ は、酸素原子または式 $N-D$ を有する基 (式中、 $D$ は水素原子、 $C_6-C_{10}$ アリール基、低級アルキルスルホニル基、 $C_6-C_{10}$ アリールスルホニル基又は置換基群  $a$  から選択される基を示す。) を示し、

$Y$ は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式 $-E-CH_2-$ を有する基 (式中、 $E$ は、カルボニル基又は式 $-CH(OH)-$ を有する基を示す) を有する基を示す。

す。)、 $C_6-C_{10}$ アリーレン基又は置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリーレン基を示し、

Z は、単結合、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示し、

$R^5$  は、水素原子、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリール基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 a から選択される基を示し、

$R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示し、

置換基群 a は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

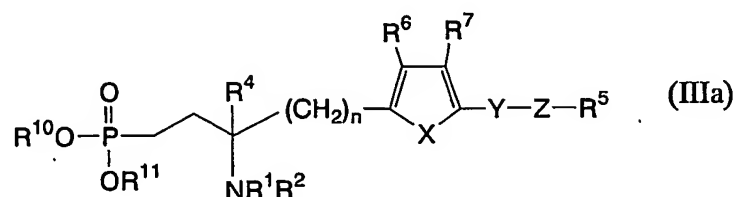
置換基群 b は、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された C

$6-C_{10}$ アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$ が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示す。]

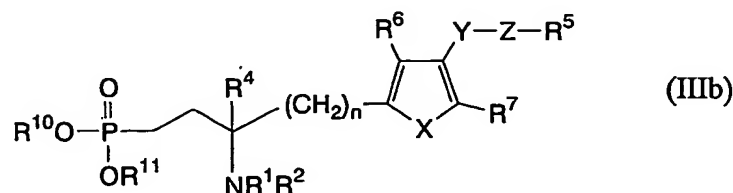
を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

8. 請求の範囲第 7 項において、式 (III) を有する化合物が、式 (III a) :



を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステル。

9. 請求の範囲第 7 項において、式 (III) を有する化合物が、式 (III b) :



を有する化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエス

テル。

10. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基、低級アルコキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

11. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

12. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1-C_4$ 脂肪族アシル基又は $C_1-C_4$ アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

13. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1-C_2$ 脂肪族アシル基又は $C_1-C_2$ アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

14. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

15. 請求の範囲第1項乃至第9項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$ 及び $R^2$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

16. 請求の範囲第1項乃至第3項及び第10項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$ が、水素原子、低級アルキル基、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基又はシリル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

17. 請求の範囲第1項乃至第3項及び第10項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$ が、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

18. 請求の範囲第1項乃至第3項及び第10項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$ が、水素原子又は $C_1 - C_4$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

19. 請求の範囲第1項乃至第3項及び第10項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$ が、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

20. 請求の範囲第1項乃至第3項及び第10項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

21. 請求の範囲第1項乃至第20項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$ が、 $C_1 - C_4$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

22. 請求の範囲第1項乃至第20項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$ が、 $C_1 - C_2$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

23. 請求の範囲第1項乃至第20項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$ が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

24. 請求の範囲第1項乃至第23項から選択されるいずれか1項において、

$n$ が、2又は3である化合物又はその薬理上許容される塩。

25. 請求の範囲第1項乃至第23項から選択されるいずれか1項において、

$n$ が、2である化合物又はその薬理上許容される塩。

26. 請求の範囲第1項乃至第25項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

27. 請求の範囲第1項乃至第25項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、式 $N-D$ を有する基（式中、 $D$ は水素原子、 $C_1-C_4$ アルキル基又はフェニル基を示す。）である化合物又はその薬理上許容される塩。

28. 請求の範囲第1項乃至第25項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、式 $NCH_3$ を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

29. 請求の範囲第1項乃至第28項から選択されるいずれか1項において、

$Y$ が、エチレン基、エチニレン基、式 $-CO-CH_2-$ を有する基、式 $-CH(OH)-CH_2-$ を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

30. 請求の範囲第1項乃至第28項から選択されるいずれか1項において、

$Y$ が、エチレン基、エチニレン基、式 $-CO-CH_2-$ を有する基又はフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

31. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項にお



いて、

Zが、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

32. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが $C_1-C_6$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_6$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

33. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが $C_1-C_5$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $C_1-C_5$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

34. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換されたエチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

35. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

36. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

37. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1$

—C<sub>10</sub>アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>アルキレン基（該置換基は、低級アルキル基及びヒドロキシ基からなる群から選択される基である。）である化合物又はその薬理上許容される塩。

38. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

39. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>10</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

40. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩。

41. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、—O—CH<sub>2</sub>—、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—、—CH<sub>2</sub>—O—、—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—O—又は—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—O—を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

42. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項において、

Zが、—CH<sub>2</sub>—O—又は—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—O—を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩。

43. 請求の範囲第1項乃至第42項から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

44. 請求の範囲第1項乃至第42項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$ が、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基から成る群から選択される基で1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル若しくは $C_6-C_{10}$ アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩。

45. 請求の範囲第1項乃至第42項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$ が、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基及び低級アルコキシ基から成る群から選択される基で1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル若しくは $C_6-C_{10}$ アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩。

46. 請求の範囲第1項乃至第42項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$ が、 $C_5-C_6$ シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

47. 請求の範囲第1項乃至第42項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$ が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

48. 請求の範囲第1項乃至第47項から選択されるいずれか1項において、

$R^6$ 及び $R^7$ が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩。

49. 請求の範囲第1項乃至第47項から選択されるいずれか1項にお

いて、

$R^6$ 及び $R^7$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

50. 請求の範囲第4項乃至第15項及び第21項乃至第49項から選択されるいずれか1項において、

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

51. 請求の範囲第4項乃至第15項及び第21項乃至第49項から選択されるいずれか1項において、

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子又は $C_1-C_4$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

52. 請求の範囲第4項乃至第15項及び第21項乃至第49項から選択されるいずれか1項において、

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩。

53. 請求の範囲第4項乃至第15項及び第21項乃至第49項から選択されるいずれか1項において、

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩。

54. 請求の範囲第1項において、

下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩：

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール及び

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール。

55. 請求の範囲第1項において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩:

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール及び

2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ブタン-1-オール。

56. 請求の範囲第4項において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩:

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}-1-ブチル エステル。

57. 請求の範囲第4項において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩:

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-

シクロヘキシルオキシブト-1-イニル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキシ) プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル。

58. 請求の範囲第7項において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩:

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル) フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル) フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)

フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸。

59. 請求の範囲第7項において、下記より選択されるいずれか1つの化合物又はその薬理上許容される塩:

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタ-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノ



イル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸。

60. T細胞のサイトカイン発現に關与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬劑、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤、

DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキル化剤、

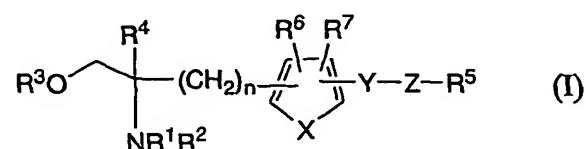
葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤、

TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤、

細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤及び

プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤

からなる群より選択される少なくとも一つの免疫抑制剤と、下記一般式（I）を有する化合物：



〔式中、

$R^1$  及び  $R^2$  は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

$R^3$  は、水素原子、低級アルキル基又はヒドロキシ基の保護基を示し、

$R^4$  は、低級アルキル基を示し、

$n$  は、1乃至6の整数を示し、

$X$  は、硫黄原子、酸素原子または式  $N-D$  を有する基（式中、 $D$  は水素原子、アリール基、低級アルキルスルホニル基、アリールスルホニル基又は置換基群  $a$  から選択される基を示す。）を示し、

$Y$  は、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式  $-E-CH_2-$  を有する基（式中、 $E$  は、カルボニル基、式  $-CH(OH)-$  を有する基を示す。）、 $C_6-C_{10}$  アリーレン基又は置換基群  $a$  から選択される基で1乃至3個置換された  $C_6-C_{10}$  アリーレン基を示し、

$Z$  は、単結合、 $C_1-C_{10}$  アルキレン基、置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、又は置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基を示し、

$R^5$  は、水素原子、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された  $C_6-C_{10}$  アリール基、又は置換基群  $a$  及び  $b$  から選択される基で1乃至3個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基を示し、

$R^6$  及び  $R^7$  は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群  $a$  から選択される基を示し、

置換基群  $a$  は、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル

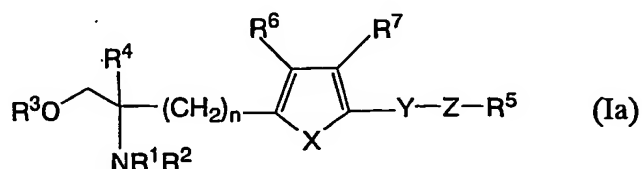
基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノー低級アルキルアミノ基、ジー低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

置換基群 b は、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$ アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$ が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示す。]

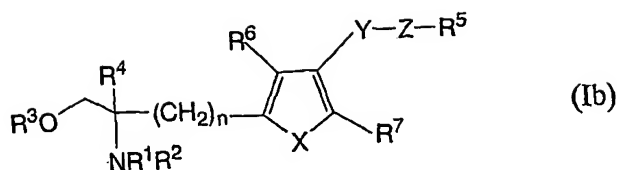
その薬理上許容される塩及びそのエステルからなる群より選ばれる少なくとも一つの化合物とからなる医薬組成物。

61. 請求の範囲第 60 項において、一般式 (I) を有する化合物が、下記一般式 (I a) :



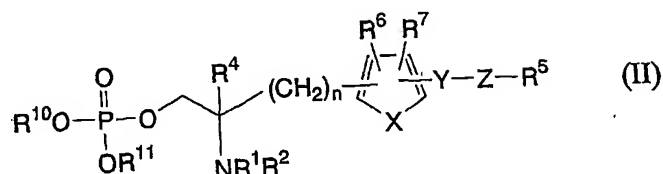
を有する化合物である医薬組成物。

62. 請求の範囲第 60 項において、一般式 (I) を有する化合物が、下記一般式 (I b) :



を有する化合物である医薬組成物。

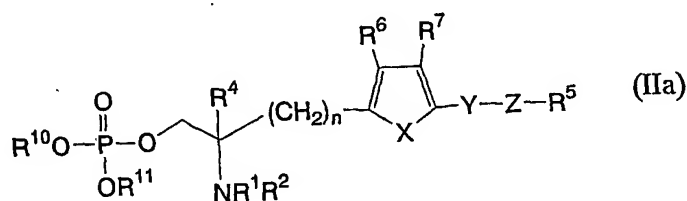
63. 請求の範囲第60項において、式(I)を有する化合物の薬理上許容されるエステルが、式(II)：



(式中、

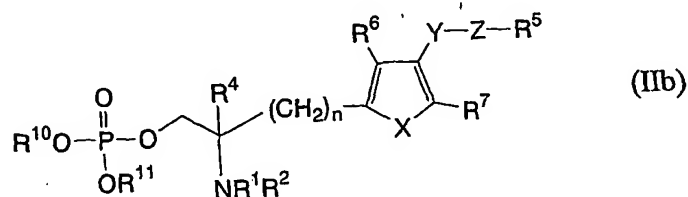
$R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示す。)を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

64. 請求の範囲第63項において、式(II)を有するエステルが、式(IIa)：



を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

65. 請求の範囲第63項において、式(II)を有するエステルが、式(IIb)：



を有する化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

66. T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成を阻害する作用を有する薬剤、

免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤、

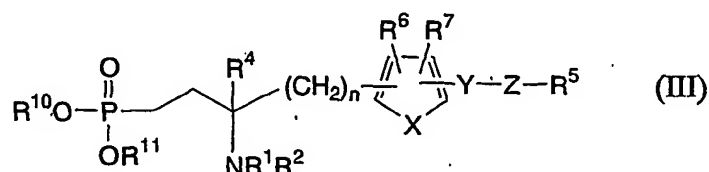
DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキル化剤、葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤、

TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤、

細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤及び

プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤

からなる群より選択される少なくとも一つの免疫抑制剤と、下記一般式 (III) を有する化合物：



[式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基又はアミノ基の保護基を示し、

R<sup>4</sup>は、低級アルキル基を示し、

nは、1乃至6の整数を示し、

Xは、硫黄原子、酸素原子または式N-Dを有する基（式中、Dは水素原子、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール基、低級アルキルスルホニル基、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリールスルホニル基又は置換基群aから選択される基を示す。）を示し、

Yは、エチレン基、ビニレン基、エチニレン基、式 $-E-CH_2-$ を有する基（式中、Eは、カルボニル基又は式 $-CH(OH)-$ を有する基を示す。）、 $C_6-C_{10}$ アリーレン基又は置換基群aから選択される基で1乃至3個置換された $C_6-C_{10}$ アリーレン基を示し、

Zは、単結合、 $C_1-C_{10}$ アルキレン基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_1-C_{10}$ アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する $C_1-C_{10}$ アルキレン基を示し、

$R^5$ は、水素原子、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $C_6-C_{10}$ アリール基、又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素環基を示し、

$R^6$ 及び $R^7$ は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群aから選択される基を示し、

$R^{10}$ 及び $R^{11}$ は、同一又は異なって、水素原子又はリン酸基の保護基を示し、

置換基群aは、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、低級脂肪族アシル基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級脂肪族アシルアミノ基、シアノ基及びニトロ基からなる群を示し、

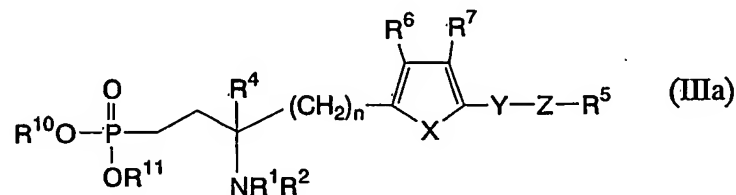
置換基群bは、 $C_3-C_{10}$ シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$ アリール基、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員複素

環基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_6-C_{10}$  アリール基、及び置換基群 a から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、硫黄原子、酸素原子及び／又は窒素原子を 1 乃至 3 個含む 5 乃至 7 員複素環基からなる群を示す。

但し、 $R^5$  が水素原子であるとき、Z は、分岐した  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基、又は置換基群 a 及び b から選択される基で 1 乃至 3 個置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有する  $C_1-C_{10}$  アルキレン基を示す。]

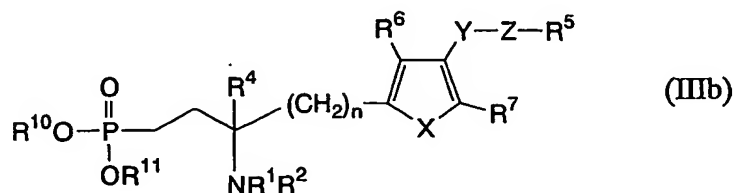
を有する化合物又はその薬理上許容される塩及びそのエステルからなる群より選ばれる少なくとも一つの化合物とからなる医薬組成物。

67. 請求の範囲第 66 項において、式 (III) を有する化合物が、式 (IIIa) :



を有する化合物である医薬組成物。

68. 請求の範囲第 66 項において、式 (III) を有する化合物が、式 (IIIb) :



を有する化合物である医薬組成物。

69. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基、低級アルコキシカルボニル基、アラルキルオキシカルボニル基又は置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換されたアラルキルオキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

70. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、低級脂肪族アシル基又は低級アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

71. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 - C_4$  脂肪族アシル基又は  $C_1 - C_4$  アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

72. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、 $C_1 - C_2$  脂肪族アシル基又は  $C_1 - C_2$  アルコキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

73. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、同一又は異なって、水素原子、アセチル基又はメトキシカルボニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

74. 請求の範囲第60項乃至第68項から選択されるいずれか1項に



において、

$R^1$  及び  $R^2$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

75. 請求の範囲第60項乃至第62項及び第69項乃至第74項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$  が、水素原子、低級アルキル基、低級脂肪族アシル基、芳香族アシル基、置換基群 a から選択される基で1乃至3個置換された芳香族アシル基又はシリル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

76. 請求の範囲第60項乃至第62項及び第69項乃至第74項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$  が、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

77. 請求の範囲第60項乃至第62項及び第69項乃至第74項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$  が、水素原子又は  $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

78. 請求の範囲第60項乃至第62項及び第69項乃至第74項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$  が、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

79. 請求の範囲第60項乃至第62項及び第69項乃至第74項から選択されるいずれか1項において、

$R^3$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

80. 請求の範囲第60項乃至第79項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$  が、 $C_1 - C_4$  アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩

である医薬組成物。

81. 請求の範囲第60項乃至第79項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$ が、 $C_1 - C_2$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

82. 請求の範囲第60項乃至第79項から選択されるいずれか1項において、

$R^4$ が、メチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

83. 請求の範囲第60項乃至第82項から選択されるいずれか1項において、

$n$ が、2又は3である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

84. 請求の範囲第60項乃至第82項から選択されるいずれか1項において、

$n$ が、2である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

85. 請求の範囲第60項乃至第84項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、硫黄原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

86. 請求の範囲第60項乃至第84項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、酸素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

87. 請求の範囲第60項乃至第84項から選択されるいずれか1項において、

$X$ が、式 $N-D$ を有する基（式中、 $D$ は水素原子、 $C_1 - C_4$ アルキル基又はフェニル基を示す。）である化合物又はその薬理上許容される塩であ

る医薬組成物。

88. 請求の範囲第60項乃至第84項から選択されるいずれか1項において、

Xが、式 $\text{N}-\text{CH}_3$ を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

89. 請求の範囲第60項乃至第88項から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、エチニレン基、式 $-\text{CO}-\text{CH}_2-$ を有する基、式 $-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-$ を有する基、フェニレン基、又はハロゲン原子及び低級アルキル基からなる群より選択される基で1乃至3個置換されたフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

90. 請求の範囲第60項乃至第88項から選択されるいずれか1項において、

Yが、エチレン基、エチニレン基、式 $-\text{CO}-\text{CH}_2-$ を有する基又はフェニレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

91. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、 $\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン基又は置換基群a及びbから選択される基で1乃至3個置換された $\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

92. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換された $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

93. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項に

において、

ZがC<sub>1</sub>－C<sub>5</sub>アルキレン基又はヒドロキシ基で1乃至3個置換されたC<sub>1</sub>－C<sub>5</sub>アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

94. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン基、トリメチレン基、テトラメチレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換されたエチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

95. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン基、トリメチレン基若しくはテトラメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

96. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、エチレン若しくはトリメチレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

97. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキレン基、又は1個のヒドロキシ基で置換された、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>－C<sub>10</sub>アルキレン基（該置換基は、低級アルキル基及びヒドロキシ基からなる群から選択される基である。）である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

98. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子若しくは硫黄原子を有するC<sub>1</sub>

—C<sub>10</sub> アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

99. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>10</sub> アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

100. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、炭素鎖中若しくは鎖端に酸素原子を有するC<sub>1</sub>—C<sub>6</sub> アルキレン基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

101. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、—O—CH<sub>2</sub>—、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—、—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—、—CH<sub>2</sub>—O—、—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—O—又は—(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>—O—を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

102. 請求の範囲第60項乃至第90項から選択されるいずれか1項において、

Zが、—CH<sub>2</sub>—O—又は—(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>—O—を有する基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

103. 請求の範囲第60項乃至第102項から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

104. 請求の範囲第60項乃至第102項から選択されるいずれか1項において、

R<sup>5</sup>が、C<sub>3</sub>—C<sub>10</sub> シクロアルキル基、C<sub>6</sub>—C<sub>10</sub> アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲン低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基から成る群から選択される基で1乃至3個置

換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

105. 請求の範囲第60項乃至第102項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$  が、 $C_3-C_{10}$  シクロアルキル基、 $C_6-C_{10}$  アリール基、又はハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基及び低級アルコキシ基から成る群から選択される基で1乃至3個置換された  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル若しくは  $C_6-C_{10}$  アリール基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

106. 請求の範囲第60項乃至第102項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$  が、 $C_5-C_6$  シクロアルキル基、フェニル基又はナフチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

107. 請求の範囲第60項乃至第102項から選択されるいずれか1項において、

$R^5$  が、シクロヘキシル基又はフェニル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

108. 請求の範囲第60項乃至第107項から選択されるいずれか1項において、

$R^6$  及び  $R^7$  が、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、低級アルコキシ基又は低級アルキルチオ基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

109. 請求の範囲第60項乃至第107項から選択されるいずれか1項において、

$R^6$  及び  $R^7$  が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

110. 請求の範囲第63項乃至第74項及び第80項乃至第109項から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  が、同一又は異なっ

て、水素原子又は低級アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

111. 請求の範囲第63項乃至第74項及び第80項乃至第109項から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子又は $C_1-C_4$ アルキル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

112. 請求の範囲第63項乃至第74項及び第80項乃至第109項から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、同一又は異なって、水素原子、メチル基又はエチル基である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

113. 請求の範囲第63項乃至第74項及び第80項乃至第109項から選択されるいずれか1項において、 $R^{10}$ 及び $R^{11}$ が、水素原子である化合物又はその薬理上許容される塩である医薬組成物。

114. 請求の範囲第60項において、一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、

2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブ

チル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフ  
エン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イ  
ニル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チ  
オフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-  
イニル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)  
チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペン  
ト-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペン  
ト-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロ  
プ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロ  
プ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチオフエノキシ)  
プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-  
1-イニル)チオフエン-2-イル]ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブ  
ト-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト  
-1-イニル]チオフエン-2-イル}ブタン-1-オール、  
2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシ)プロ



プー１－イニル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－[５－(４－ベンジルオキシプト－１－イ  
ニル)チオフェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－[５－(４－シクロヘキシルブタノイル)チ  
オフェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－[５－(４－フェニルブタノイル)チオフェ  
ン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－[５－(５－シクロヘキシルペンタノイル)  
チオフェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－[５－(５－フェニルペンタノイル)チオフ  
ェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[５－(４－フルオロフェニル)ペン  
タノイル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－エチル－４－[５－(５－シクロヘキシルペンチル)チオ  
フェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－エチル－４－[５－(５－シクロヘキシルペント－１－  
イニル)チオフェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－エチル－４－[５－(５－シクロヘキシルペンタノイル)  
チオフェン－２－イル]ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[３－(４－クロロフェノキシ)プロ  
プー１－イニル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[３－(３－メチルフェノキシ)プロ  
プー１－イニル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[３－(３,４－ジメチルフェノキシ)  
プロプー１－イニル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[３－(３－メトキシフェノキシ)プ  
ロプー１－イニル]チオフェン－２－イル}ブタン－１－オール、  
２－アミノ－２－メチル－４－{５－[３－(３,４－ジメトキシフェノキ

シ) プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)  
 シ) プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロ  
 ロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール及び  
 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシプロ  
 プ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ブタン-1-オール。

115. 請求の範囲第60項において、一般式(I)を有する化合物、  
 その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群  
 が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエス  
 テルからなる群である医薬組成物:

2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-  
 2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-  
 イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)  
 フラン-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-  
 1-イニル)フラン-2-イル]ブタン-1-オール、  
 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)  
 フラン-2-イル]ブタン-1-オール及び  
 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ  
 シ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ブタン-1-オール。

116. 請求の範囲第60項において、一般式(I)を有する化合物、  
 その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群  
 が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエス  
 テルからなる群である医薬組成物:

2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペン

ー1ーイニル) ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー{1ーメチルー5ー[3ー(4ーメチルフェノキシ)プロプー1ーイニル]ピロールー2ーイル}ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーメチルー5ー(4ーシクロヘキシルオキシブトー1ーイニル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー{1ーメチルー5ー[3ー(3, 4ージメチルフェノキシ)プロプー1ーイニル]ピロールー2ーイル}ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーメチルー5ー(5ーフェニルペンタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーメチルー5ー(5ーシクロヘキシルペンタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーメチルー5ー(4ーフェニルブタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーメチルー5ー(4ーシクロヘキシルブタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーエチルー5ー(5ーフェニルペンタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーエチルー5ー(5ーシクロヘキシルペンタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール、  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーエチルー5ー(4ーフェニルブタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール及び  
2ーアミノー2ーメチルー4ー[1ーエチルー5ー(4ーシクロヘキシルブタノイル)ピロールー2ーイル]ブタンー1ーオール。

117. 請求の範囲第63項において、一般式(II)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエス

テルからなる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペント-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エ

ステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(3-シクロヘキシルメトキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-エチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフェン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3,5-ジメ

トキシフェノキシ) プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ) プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ) プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}-1-ブチル エステル。

118. 請求の範囲第63項において、一般式(I I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペンチル) フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル) フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-フェニルペント-1-イニル) フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(4-シクロヘキシルオキシプト-1-イニル) フラン-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル) フラン-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{5-[3-(3, 4-ジメチルフェノキシ) プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}-1-ブチル エステル。

119. 請求の範囲第63項において、一般式(I I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエス

テルからなる群である医薬組成物：

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル、

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル)ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル及び

リン酸 モノ 2-アミノ-2-メチル-4-[1-エチル-5-(4-シ



クロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]-1-ブチル エステル。

120. 請求の範囲第66項において、一般式(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物:

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブチル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブト-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペン

ト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-メトキシフェニル)ペン  
ト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロ  
プ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-エチルフェノキシ)プロ  
プ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-メチルチオフェノキシ)  
プロプ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-  
1-イニル)チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-フルオロフェノキシ)ブ  
ト-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[4-(4-メチルフェノキシ)ブト  
-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(3-シクロヘキシルメトキシ)プロ  
プ-1-イニル]チオフェン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-ベンジルオキシブト-1-イ  
ニル)チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルブタノイル)  
チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-フェニルブタノイル)チオフェ  
ン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)  
チオフェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンタノイル)チオフ  
ェン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[5-(4-フルオロフェニル)ペン

タノイル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンチル)チオフエン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)チオフエン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-エチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)チオフエン-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-クロロフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-メトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,5-ジメトキシフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸、  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸及び  
3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(4-アセチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]チオフエン-2-イル}ペンチルホスホン酸。

121. 請求の範囲第66項において、一般式(I I I)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペンチル)フラン-

2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-フェニルペント-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[5-(5-シクロヘキシルペンタノイル)フラン-2-イル]ペンチルホスホン酸及び

3-アミノ-3-メチル-5-{5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]フラン-2-イル}ペンチルホスホン酸。

122. 請求の範囲第66項において、一般式(III)を有する化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群が、下記化合物、その薬理上許容される塩及びその薬理上許容されるエステルからなる群である医薬組成物：

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペント-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(4-メチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルオキシブト-1-イニル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-{1-メチル-5-[3-(3,4-ジメチルフェノキシ)プロプ-1-イニル]ピロール-2-イル}ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-フェニルペンタノイル)ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、

3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(5-シクロヘキシルペ

ンタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-フェニルブタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-メチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-フェニルペンタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(5-シクロヘキシルペンタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸、  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-フェニルブタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸及び  
 3-アミノ-3-メチル-5-[1-エチル-5-(4-シクロヘキシルブタノイル) ピロール-2-イル]ペンチルホスホン酸。

123. 請求の範囲第60項乃至第122項から選択されるいずれか1項において、免疫抑制剤が、

T細胞のサイトカイン発現に関与する細胞内シグナルの伝達を阻害する作用を有する薬剤(該薬剤は、サイクロスポリンA、タクロリムス、ラパマイシン、グスベリムス、エベロリムス、トレスベリムス、アニスベリムス、SDZ-281-240、ABT-281、チグデリムス、A-119435又は17-エチル-1,14-ジヒドロキシー-12-[2-[4-(2-フェニルヒドラジノカルボニルオキシ)-3-メトキシシクロヘキシル]-1-メチルビニル]-23,25-ジメトキシ-13,19,21,27-テトラメチル-11,28-ジオキサ-4-アザトリシクロ[22.3.1.0<sup>4,9</sup>]オクタコス-18-エン-2,3,10,16-テトロンである。)、

免疫細胞中でのヌクレオシド合成阻害する作用を有する薬剤(該薬剤は、ミゾリピン、アザチオプリン、ミコフェノール酸、レフルノマイド、メリメンポディブ、HMR-1279、TSK-204又はSP-1000

30である。)、

免疫細胞に対するサイトカインの作用を阻害し抗リウマチ作用を有する薬剤（該薬剤は、T-614、アクタリット、サラゾスルファピリジン又はCDC-801である。）、

DNA鎖の破壊又はDNAの合成障害により細胞死を引き起こすアルキル化剤（該アルキル化剤は、シクロフォスファミドである。）、

葉酸産生を抑制して核酸代謝を阻害する代謝拮抗剤（該代謝拮抗剤は、メトトレキセートである。）、

TNF- $\alpha$ 抑制作用を有する蛋白質製剤（該蛋白質製剤は、レミケード、エンブレル、ダクリズマブ、バシリキシマブ、アルムツズマブ、オマリズマブ、BMS-188667、CDP-571、イノリモマブ、ATM-027又はBTI-322である。）、

細胞内のステロイドレセプターに結合して複合体を形成し、染色体上の反応部位に結合することにより合成された蛋白質により免疫抑制作用を示すステロイドホルモン剤（該ステロイドホルモン剤は、プレドニゾロンである。）又は

プロスタグランジンの産生を抑制する物質及び／又はプロスタグランジンの作用に拮抗する非ステロイド系抗炎症剤（該非ステロイド系抗炎症剤は、ロキソプロフェンナトリウム、ジクロフェナクナトリウム、メロキシカム、セレコキシブ、ロフェコキシブである。）

からなる群より選択される少なくとも一つの薬剤である医薬組成物。

124. 請求項60項乃至第122項から選択されるいずれか1項において、免疫抑制剤が、サイクロスポリンA、タクロリムス、ラパマイシン、レフルノマイド、メトトレキセート、レミケード及びエンブレルからなる群より選択される少なくとも一つの薬剤である医薬組成物。

125. 請求の範囲第1項乃至第59項から選択されるいずれか1項に記載される化合物、その薬理上許容される塩又はその薬理上許容されるエステルを有効成分として含有する医薬組成物。

1 2 6. 自己免疫疾患の予防又は治療のための、請求の範囲第 1 2 5 項に記載の医薬組成物。

1 2 7. 自己免疫疾患が慢性関節リウマチである、請求の範囲第 1 2 6 項に記載の医薬組成物。

1 2 8. 臓器移植での拒絶反応を抑制するための、請求の範囲第 1 2 5 項に記載の医薬組成物。

1 2 9. 請求の範囲第 6 0 項乃至第 1 2 5 項から選択されるいずれか 1 項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする自己免疫疾患の予防又は治療方法。

1 3 0. 請求の範囲第 6 0 項乃至第 1 2 5 項から選択されるいずれか 1 項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする慢性関節リウマチの予防又は治療方法。

1 3 1. 請求の範囲第 6 0 項乃至第 1 2 5 項から選択されるいずれか 1 項に記載される医薬組成物の有効量を、哺乳動物に投与することを特徴とする臓器移植での拒絶反応の予防又は治療方法。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/00136

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07D207/335, 307/52, 333/20, A61K31/341, 31/40, 31/381,  
A61P1/04, 1/16, 3/10, 7/00, 7/06, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12,  
17/00, 17/06, 19/02, 21/00, 25/00, 25/14, 25/16, 25/18, 25/28,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D207/335, 307/52, 333/20, A61K31/341, 31/40, 31/381

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 96/06068 A (Yoshitomi Pharmaceutical Industries, Ltd.), 29 February, 1996 (29.02.96), Full text & EP 778263 A	1-128
P,A	WO 02/06268 A (Sankyo Co., Ltd.), 24 January, 2002 (24.01.02), Full text & JP 2002-167382 A	1-128
P,A	WO 02/18395 A (Merck & Co., Inc.), 07 March, 2002 (07.03.02), Full text & US 2002/0091105 A	1-128

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:  
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  
"E" earlier document but published on or after the international filing date  
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone  
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art  
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
07 February, 2003 (07.02.03)

Date of mailing of the international search report  
25 February, 2003 (25.02.03)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/00136

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,A	WO 02/76995 A (NOVARTIS AG), 03 October, 2002 (03.10.02), Full text (Family: none)	1-128

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/00136

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 129-131

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
The invention as set forth in claims 129 to 131 is relevant to methods for treatment of the human body by therapy.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/00136

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> 29/00, 31/04, 31/12, 35/02, 37/00, 37/06, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.<sup>7</sup> C07D207/335, 307/52, 333/20, A61K31/341, 31/40, 31/381, A61P1/04, 1/16, 3/10, 7/00, 7/06, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 13/12, 17/00, 17/06, 19/02, 21/00, 25/00, 25/14, 25/16, 25/18, 25/28, 29/00, 31/04, 31/12, 35/02, 37/00, 37/06, 43/00

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.<sup>7</sup> C07D207/335, 307/52, 333/20, A61K31/341, 31/40, 31/381

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 96/06068 A (吉富製薬株式会社) 1996. 02. 29, 文献全体 & EP 778263 A	1-128
P, A	WO 02/06268 A (三共株式会社) 2002. 01. 24, 文献全体 & JP 2002-167382 A	1-128
P, A	WO 02/18395 A (MERCK & CO., INC.) 2002. 03. 07, 文献全体 & US 2002/0091105 A	1-128

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

07. 02. 03

国際調査報告の発送日

25.02.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一

4P

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
P, A	WO 02/76995 A (NOVARTIS AG) 2002. 10. 03, 文献全体 (ファミリーなし)	1-128

## 第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 129-131 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。つまり、

請求の範囲129-131の発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

2. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところこの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。